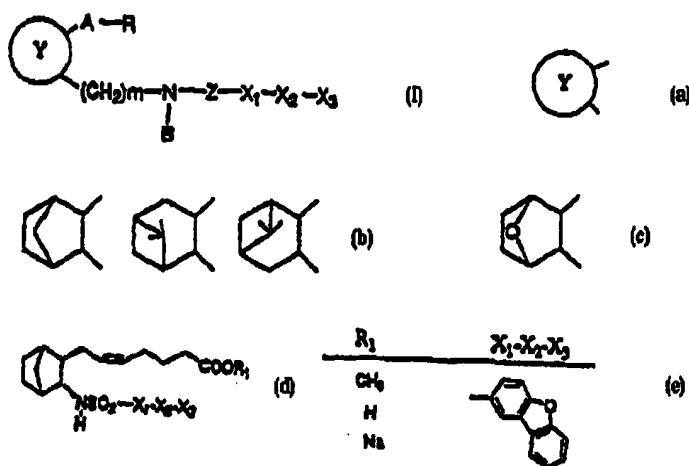


<p>(51) 国際特許分類6 C07C 233/52, 233/84, 271/24, 311/06, 311/11, 311/13, 311/19, C07D 493/08, 495/08, A61K 31/16, 31/18, 31/27, 31/33, 31/34, 31/35, 31/38</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO97/00853</p> <p>(43) 国際公開日 1997年1月9日 (09.01.97)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP96/01685</p> <p>(22) 国際出願日 1996年6月19日 (19.06.96)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平7/154575 1995年6月21日 (21.06.95) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 塩野義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP] 〒541 大阪府大阪市中央区道修町三丁目1番8号 Osaka, (JP)</p> <p>(72) 発明者: および</p> <p>(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 大谷光昭 (OHTANI, Mitsuaki) [JP/JP] 〒630 奈良県奈良市高畑町1342 Nara, (JP) 有村昭典 (ARIMURA, Akinori) [JP/JP] 〒558 大阪府大阪市住吉区南住吉1丁目7-32-304 Osaka, (JP) 釣 達男 (TSURI, Tatsuo) [JP/JP] 〒651-11 兵庫県神戸市北区鈴蘭台北町9丁目20番6号 Hyogo, (JP) 岸野淳二 (KISHINO, Junji) [JP/JP] 〒654-01 兵庫県神戸市須磨区神の谷3丁目3番17号 Hyogo, (JP)</p>	<p>本摩恒利 (HONMA, Tsunetoshi) [JP/JP] 〒630-02 奈良県生駒市青山台117-42 Nara, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 青山 稔, 外 (AOYAMA, Tamotsu et al.) 〒540 大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル 青山特許事務所 Osaka, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AL, AU, BB, BG, BR, CA, CN, CZ, EE, GE, HU, IL, IS, JP, KR, LK, LR, LT, LV, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, SG, SI, SK, TR, TT, UA, US, UZ, VN, ARIPO特許 (KE, LS, MW, SD, SZ, UG), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>	

(54) Title: BICYCLIC AMINO DERIVATIVES AND PGD₂ ANTAGONIST CONTAINING THE SAME

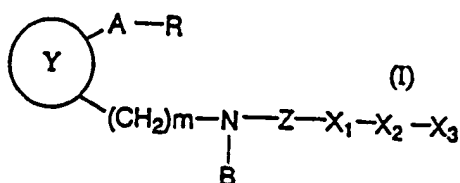
(54) 発明の名称 ビシクロ環系アミノ誘導体およびそれを含有するPGD₂拮抗剤



(57) Abstract

Compounds of general formula (I), salts thereof or hydrates thereof wherein (a) represents (b) or (c), for example, the compounds (d) and (e), which are useful as a PGD₂ antagonist and thus usable in, for example, a remedy for systemic mastocytosis or systemic mast cell

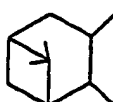
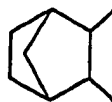
式 (I) :



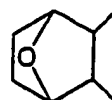
(式中、



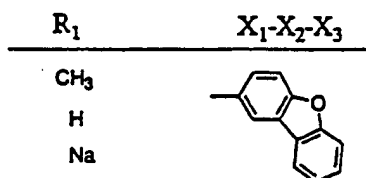
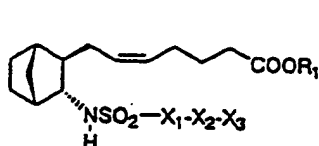
は、



または



を表し、一例として、



である化合物またはその塩もしくは水和物は、PGD₂拮抗剤として有用であり、例えば全身性肥満細胞症や全身性肥満細胞活性化障害の治療剤、抗気管収縮剤、抗喘息剤、抗アレルギー性鼻炎剤、抗アレルギー性結膜炎剤、抗蕁麻疹剤、虚血再灌流傷害治療薬、炎症剤として用いることができる。特に鼻閉症の治療に有用である。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AL アルバニア
AM アルメニア
AT オーストリア
AU オーストラリア
AZ アゼルバイジャン
BA ボスニア・ヘルツェゴビナ
BB ベルバドス
BE ベルギー
BF ブルキナ・ファソ
BG ブルガリア
BJ ベナン
BR ブラジル
BY ベラルーシ
CA カナダ
CF 中央アフリカ共和国
CG コンゴ
CH スイス
CI コート・ジボアール
CM カメルーン
CN 中国
CU キューバ
CZ チェコ共和国

DE ドイツ
DK デンマーク
EE エストニア
ES スペイン
FI フィンランド
FR フランス
GB ガボン
GE ギニア
GN ギニア
GR キリシヤ
HU ハンガリー
IE アイルランド
IL イスラエル
IT イタリア
JP 日本
KE ケニア
KG キルギスタン
KP 朝鮮民主主義人民共和国
KR 大韓民国
KZ カザフスタン

LI リヒテンシュタイン
LK センチラル
LR スリランカ
LS リベリア
LT レソト
LU リトアニア
LV ルクセンブルグ
MC モナコ
MD モルドヴァ共和国
MG マダガスカル
MK マケドニア共和国
ML マリ
MN モンゴル
MR モリタニア
MW マラウイ
MX メキシコ
NE ニジェール
NL オランダ
NO ノルウェー
NZ ニュー・ジーランド

PL ポーランド
PT ポルトガル
RO ルーマニア
RU ロシア連邦
SD スーダン
SE スウェーデン
SG シンガポール
SI スロベニア
SK スロヴァキア
SN セネガル
SZ スワジランド
TD チャド
TG トーゴ
TJ タジキスタン
TM トルクメニスタン
TR トルコ
TT トリニダード・トバゴ
UA ウクライナ
UG ウガンダ
US アメリカ合衆国
UZ ウズベキスタン
VN ヴィエトナム

明 細 書

ビシクロ環系アミノ誘導体およびそれを含有するPGD₂拮抗剤

技術分野

本発明は、ビシクロ環系アミノ誘導体およびそれらを含有するプロスタグランジンD₂（以下、PGD₂という）拮抗剤に関する。

背景技術

本発明に関わるビシクロ環系アミノ誘導体の一部のものはトロンボキサンA₂（TXA₂）拮抗剤として有用であることが知られている（特公平5-79060号明細書）。しかしながら、特公平5-79060号に記載された化合物については、いずれもTXA₂拮抗剤としての有用性が開示されているにすぎず、本発明で明らかにされたPGD₂拮抗剤としての用途については、何ら示唆されていない。

即ち、TXA₂は、その作用として血小板凝集作用、血栓形成作用等があることが知られているが、TXA₂拮抗剤は、TXA₂に拮抗することで、抗血栓剤、心筋梗塞、喘息の治療剤として有用であると考えられている。

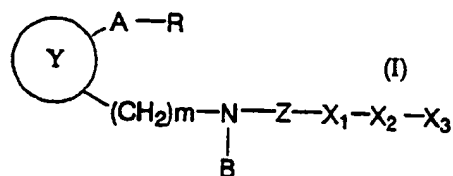
一方、本発明のPGD₂拮抗剤は、PGD₂の生産過多に起因する症状の改善、さらに詳しくは、肥満細胞機能不全が関与する疾患、例えば全身性肥満細胞症及び全身性肥満細胞活性化障害の治療剤、さらには抗気管収縮剤、抗喘息剤、抗アレルギー性鼻炎剤、抗アレルギー性結膜炎剤、抗蕁麻疹剤、虚血再灌流傷害治療薬、抗炎症剤として有用である。

(cyclooxygenase) により、アラキドン酸 (arachidonic acid) から PGG_2 、 PGH_2 を経て産生される。 PGD_2 は種々の強力な生理的、病的な作用を有し、例えば、強い気管収縮を起こし気管支喘息の病態を形づくる、さらに全身性アレルギー状態においては末梢血管を拡張しアナフィラキシーショックの原因となる、などである。とりわけ PGD_2 をアレルギー性鼻炎の鼻閉症状の発現の原因物質の一つであるとする考えが注目を集めている。そのため、鼻閉症状の軽減を目的とする薬物として PGD_2 の生合成阻害剤、あるいは受容体拮抗剤の開発が考えられている。しかし、 PGD_2 の生合成阻害剤は他の生体内でのプロスタグランジン類の合成に大きな影響を及ぼす可能性があることから、 PGD_2 受容体に特異的な、 PGD_2 受容体拮抗剤 (遮断薬) の開発が望まれている。

発明の開示

本発明者らは、 PGD_2 受容体に特異的な PGD_2 受容体拮抗剤 (遮断薬) を開発するために鋭意、研究した結果、下記一般式 (I) で示される化合物またはその塩が PGD_2 受容体拮抗剤として強力な作用を有し、かつ化学的、生化学的に安定な化合物であることを見出し、本発明を完成するに至った。

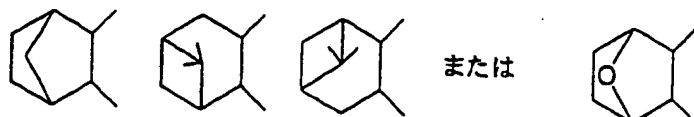
即ち、本発明は、式 (I) で示される化合物またはその塩もしくは水和物を有効成分として含有する PGD_2 拮抗剤を提供するものである。：



(式中、



は、



を表わし、

A はヘテロ原子もしくはフェニレンを介在していてもよく、オキシ基を有してい

でもよく、および／または不飽和結合を有していてもよいアルキレン；

Bは水素、アルキル、アラルキルまたはアシル；

RはCOOR₁、CH₂OR₂またはCON(R₃)R₄；

R₁は水素またはアルキル；

R₂は水素またはアルキル；

R₃およびR₄はそれぞれ独立して水素、アルキル、ヒドロキシまたはアルキルスルホニル；

X₁は単結合、フェニレン、ナフチレン、チオフェンジイル、インドールジイルまたはオキサゾールジイル；

X₂は単結合、—N=N—、—N=CH—、—CH=N—、—CH=N—N—、
—CH=N—O—、—C=NNHCSNH—、—C=NNHCONH—、
—CH=CH—、—CH(OH)—、—C(C₁)=C(C₁)—、
—(CH₂)_n—、エチニレン、—N(R₅)—、—N(R₅₁)CO—、
—N(R₅₂)SO₂—、—N(R₅₃)CON(R₅₄)—、
—CON(R₅₅)—、—SO₂N(R₅₆)—、—O—、—S—、—SO—、
—SO₂—、—CO—、オキサジアゾールジイル、チアジアゾールジイル
またはテトラゾールジイル；

X₃はアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、ヘテロ環、
シクロアルキル、シクロアルケニル、チアソリニリデンメチル、チアソリジニ
リデンメチル、—CH=NR₆または—N=C(R₇)R₈；

R₅、R₅₁、R₅₂、R₅₃、R₅₄、R₅₅およびR₅₆は水素またはアルキル；

R₆は水素、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルバモイルオキシ、チオ
カルバモイルオキシ、ウレイドまたはチオウレイド；

R₇およびR₈はそれぞれ独立してアルキル、アルコキシまたはアリール；

nは1または2；

Zは—SO₂—または—CO—；

mは0または1；

これらの定義において、置換基が環状のものはニトロ、アルコキシ、スルファ
モイル、置換もしくは非置換アミノ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、ハロ

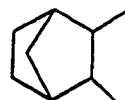
ゲン、アルキル、アルキニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アラルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、メシロキシ、シアノ、アルケニルオキシ、ヒドロキシアルキル、トリフルオロメチル、アルキルチオ、 $-N=PPh_3$ 、オキソ、チオキソ、ヒドロキシイミノ、アルコキシイミノ、フェニルおよびアルキレンジオキシから選ばれる1～3個の基で置換されていてもよい)

発明を実施するための最良の形態

上記のPGD₂拮抗剤となり得る化合物を更に具体的に示せば、式(I)で示される化合物において、



が、

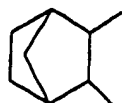


を表わし、mが0であり、ZがSO₂のとき、X₁およびX₂がともに単結合であり、X₃がアルキル、フェニル、ナフチル、スチリル、キノリルまたはチエニルを表わし、これらの置換基のうち、環状のものがニトロ、アルコキシ、置換もしくは非置換アミノ、ハロゲン、アルキルおよびヒドロキシアルキルから選ばれる1～3個の基で置換されていてもよい化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。

同様に、式(I)で示される化合物において、

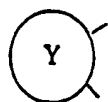


が、

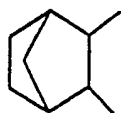


を表わし、mが1のとき、X₁およびX₂がともに単結合であり、X₃がハロゲンで置換されていてもよいフェニルである化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。

同様に、式 (I) で示される化合物において、

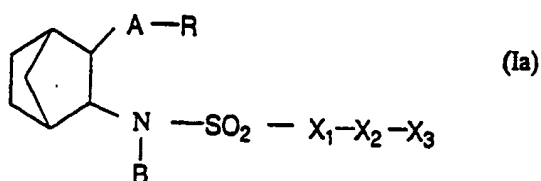


が、



を表わし、 m が 1 のとき、 X_1 がフェニル、 X_2 が $-CH_2-$ または $-N=N-$ であり、 X_3 がフェニルである化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。

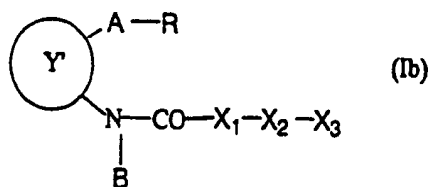
同様に、式 (I) で示される化合物は、式 (Ia) :



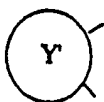
(式中、 A 、 B 、 R 、 X_1 、 X_2 および X_3 が前記と同意義である。

ただし、(1) X_1 および X_2 が単結合であり、 X_3 が置換もしくは非置換フェニルまたはナフチル、および (2) A が 5-ヘプテニレン、 R が $COOR_1$ (R_1 は水素またはメチル)、 X_1 が 1,4-フェニレン、 X_2 が単結合、 X_3 がフェニルである場合を除く) で示される化合物またはその塩もしくは水和物として例示される。

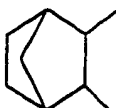
同様に、式 (I) で示される化合物は、式 (Ib) :



(式中、



は、



または



を表わし、 A 、 B 、 R 、 X_1 、 X_2 および X_3 が前記と同意義である。ただし、 X

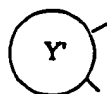
1 および X_2 が単結合であり、 X_3 がフェニルである場合および X_1 が単結合で X_2 が $-O-$ であるとき、 X_3 がベンジルである場合を除く) で示される化合物またはその塩もしくは水和物として例示される。

更に具体的には、式 (I a) で示される化合物において、 X_1 および X_2 が単結合であり、 X_3 がイソオキサゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、モルホルリル、インドリル、ベンゾフリル、ジベンゾフリル、ジベンゾジオキシニル、ベンゾチエニル、ジベンゾチエニル、カルバゾリル、キサントニル、フェナントリジニル、ジベンゾオキセピニル、ジベンゾチエピニル、シンノリル、クロメニル、ベンゾイミダゾリルまたはジヒドロベンゾチエピニルである化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。

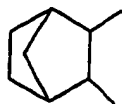
同様に、式 (I a) で示される化合物において、 X_1 が単結合、 X_2 がフェニレン、 X_3 がアルケニル、アルキニル、 $-CH=NR_6$ または $-N=C(R_7)R_8$ を表わす化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。

同様に、式 (I a) で示される化合物において、 R が $COOR_1$ 、 X_1 がフェニレンまたはチオフェンジイル、 X_2 が単結合、 $-N=N-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-CONH-$ 、 $-NHCO-$ またはエチニレンおよび X_3 がフェニル、チアゾリニリデンメチル、チアゾリジニリデンメチルまたはチエニルを表わす化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。

更に具体的には、式 (I b) で示される化合物において、



が、

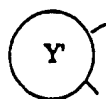


を表わす化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。さらに好ましい態様としては、式 (I b) で示される化合物において、 R が $COOR_1$ (R_1 は前記と同意義である) で示される化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。

同様に、式 (I b) で示される化合物において、 X_1 がフェニレンまたはチオフェンジイル、 X_2 が単結合、 $-N=N-$ 、 $-CH=CH-$ 、エチニレン、 $-O-$

一、 $-S-$ 、 $-CO-$ 、 $-CON(R_{55})-$ (R_{55} は前記と同意義である)、
 $-N(R_{51})CO-$ (R_{51} は前記と同意義である) および X_3 がフェニルである
 化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。

更に具体的には、式 (I b) で示される化合物において、



が、



を表わす化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。さらに好ましい態様としては、 B が水素、 X_1 および X_2 がともに単結合であり、 X_3 がチエニル、チアゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、ピロリル、ピリジル、ベンゾフリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチエニル、ジベンゾフリル、ジベンゾチエニル、キノリルまたはインドリルである化合物またはその塩が挙げられる。同様に、 X_1 がフェニレン、チオフェンジイル、インドールジイルまたはオキサゾールジイル、 X_2 が単結合、 $-N=N-$ 、 $-CH=CH-$ 、エチニレン、 $-S-$ または $-O-$ 、および X_3 がアリールまたはヘテロ環である化合物またはその塩もしくは水和物が挙げられる。

尚、上記一般式 (I a) および (I b) で示される化合物は本発明者らにより合成された新規化合物である。

本明細書において用いる各種語句の定義は、以下の通りである。

「アルキレン」とは、 $C_1 \sim C_9$ の直鎖状又は分枝状のアルキレンを意味し、例えば、メチレン、メチルメチレン、ジメチルメチレン、メチルエチルメチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン、ヘプタメチレン、オクタメチレンまたはノナメチレン等が挙げられる。上記アルキレンは、ヘテロ原子（酸素原子、硫黄原子または窒素原子等）もしくはフェニレン（例えば、1, 4-フェニレン、1, 3-フェニレン、1, 2-フェニレン等）を介在していてもよく、オキソ基を有してもよく、および／または二重結合または三重結合を鎖上に1個又はそれ以上、任意の位置に含んでいてもよい。例えば、

$-(CH_2)_2-O-CH_2-$, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_5-$, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_6-$, $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_3-S-(CH_2)_2-$, $-CH_2-S-CH_2-$, $-CH_2-S-(CH_2)_4-$, $-CH_2-N(CH_3)-CH_2-$, $-CH_2-NH-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2-N(CH_2CH_3)-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_2-1,4\text{-フェニレン}-CH_2-$, $-(CH_2)_2-O-1,3\text{-フェニレン}-CH_2-$, $-(CH_2)_2-O-1,2\text{-フェニレン}-CH_2-$, $-(CH_2)_2-O-1,4\text{-フェニレン}-CH_2-$, $-CH=CH-S-CH_2-$, $1,4\text{-フェニレン}-CH_2-$, $-CH=CH-S-$, $1,3\text{-フェニレン}-(CH_2)_2-$, 2-オキソプロピレン , 3-オキソペンチレン , 5-オキソヘキシレン , ビニレン , 1-プロペニレン , 2-プロペニレン , 1-ブテニレン , 2-ブテニレン , 3-ブテニレン , $1,2\text{-ブタジエニレン}$, $1,3\text{-ブタジエニレン}$, 1-ペンテニレン , 2-ペンテニレン , 3-ペンテニレン , 4-ペンテニレン , $1,2\text{-ペンタジエニレン}$, $1,3\text{-ペンタジエニレン}$, $1,4\text{-ペンタジエニレン}$, $2,3\text{-ペンタジエニレン}$, $2,4\text{-ペンタジエニレン}$, 1-ヘキセニレン , 2-ヘキセニレン , 3-ヘキセニレン , 4-ヘキセニレン , 5-ヘキセニレン , $1,2\text{-ヘキサジエニレン}$, $1,3\text{-ヘキサジエニレン}$, $1,4\text{-ヘキサジエニレン}$, $1,5\text{-ヘキサジエニレン}$, $2,3\text{-ヘキサジエニレン}$, $2,4\text{-ヘキサジエニレン}$, $2,5\text{-ヘキサジエニレン}$, $3,4\text{-ヘキサジエニレン}$, $3,5\text{-ヘキサジエニレン}$, $4,5\text{-ヘキサジエニレン}$, $1,1\text{-ジメチル}-4\text{-ヘキセニレン}$, 1-ヘプテニレン , 2-ヘプテニレン , 3-ヘプテニレン , 4-ヘプテニレン , 5-ヘプテニレン , $2,2\text{-ジメチル}-5\text{-ヘプテニレン}$, 6-ヘプテニレン , $1,2\text{-ヘプタジエニレン}$, $1,3\text{-ヘプタジエニレン}$, $1,4\text{-ヘプタジエニレン}$, $1,5\text{-ヘプタジエニレン}$, $1,6\text{-ヘプタジエニレン}$, $2,3\text{-ヘプタジエニレン}$, $2,4\text{-ヘプタジエニレン}$, $2,5\text{-ヘプタジエニレン}$, $2,6\text{-ヘプタジエニレン}$, $3,4\text{-ヘプタジエニレン}$, $3,5\text{-ヘプタジエニレン}$, $3,6\text{-ヘプタジエニレン}$, $4,5\text{-ヘプタジエニレン}$, $4,6\text{-ヘプタジエニレン}$ 又は $5,6\text{-ヘプタジエニレン}$, 1-プロピニレン , 3-ブチニレン , 2-ペンチニ

レン、5-ヘキシニレン、6-ヘプチニレン、 $-(CH_2)-CH=CH-O-$
 $(CH_2)_2-$ 、 $-CH_2-S-(CH_2)_3-$ 、 $-CH_2-$ シス $-CH=CH-$ 1,
 2-フェニレン $-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 1, 4-フェニレン $-(CH_2)_2-$ 、
 -4-オキソ-4, 5-ヘキセニレン-等が挙げられる。

「アルキル」とは、 $C_1 \sim C_{20}$ の直鎖状又は分枝状のアルキルを意味し、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、*n*-ペンチル、*i*-ペンチル、ネオペンチル、*t*-ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル等が挙げられる。

「アリール」とは、 $C_6 \sim C_{14}$ の単環または縮合環を意味し、フェニル、ナフチル（例えば、1-ナフチル、2-ナフチル）、アンスリル（例えば、1-アンスリル、2-アンスリル、9-アンスリル）、フェナンスリル（例えば、2-フェナンスリル、3-フェナンスリル、9-フェナンスリル）、フルオレニル（例えば、2-フルオレニル）等が挙げられる。特に、フェニルが好ましい。

「アラルキル」とは、前記アルキル基に前記アリール基が置換したもので、これらは置換可能な全ての位置で結合しうる。例えば、ベンジル、フェネチル、フェニルプロピル（例えば、3-フェニルプロピル）、ナフチルメチル（例えば、 α -ナフチルメチル）、アンスリルメチル（例えば、9-アンスリルメチル）、フェナンスリルメチル（例えば、3-フェナンスリルメチル）等が挙げられる。

「アシル」とは、脂肪族カルボン酸由来の $C_1 \sim C_9$ のアシルを意味し、例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、バレリル等が挙げられる。

「アルキルスルホニル」とは、スルホニルに上記アルキルが置換したもので、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等が挙げられる。

「アルケニル」とは、上記アルキルに1個又はそれ以上の二重結合を有する直鎖または分岐状の $C_2 \sim C_{20}$ アルケニルを意味し、例えば、ビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1, 2-ブタジエニル、1-ペンテニル、1, 2-ペンタジエニル、2-ヘキセニル、1,

2-ヘキサジエニル、3-ヘプテニル、1, 5-ヘプタジエニル等が挙げられる。

「アルキニル」とは、上記アルキルに1個又はそれ以上の三重結合を有する直鎖または分岐状の $C_2 \sim C_{20}$ アルキニルを意味し、例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル等が挙げられる。

「ヘテロ環」とは、任意に選ばれる、酸素原子、硫黄原子および／または窒素原子を環内に1個以上含み、かつ炭素環もしくは他のヘテロ環と縮合していてもよい5～7員の環を意味し、これらは置換可能な任意の位置で結合しうる。例えば、ピロリル（例えば、1-ピロリル、3-ピロリル）、インドリル（例えば、2-インドリル、3-インドリル、6-インドリル）、カルバゾリル（例えば、2-カルバゾリル、3-カルバゾリル）、イミダゾリル（例えば、1-イミダゾリル、4-イミダゾリル）、ピラゾリル（例えば、1-ピラゾリル、3-ピラゾリル）、ベンゾイミダゾリル（例えば、2-ベンゾイミダゾリル、5-ベンゾイミダゾリル）、インダゾリル（例えば、3-インダゾリル）、インドリジニル（例えば、6-インドリジニル）、ピリジル（例えば、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル）、キノリル（例えば、8-キノリル）、イソキノリル（例えば、3-イソキノリル）、アクリジル（例えば、1-アクリジル）、フェナンスリジニル（例えば、2-フェナンスリジニル、3-フェナンスリジニル）、ピリダジニル（例えば、3-ピリダジニル）、ピリミジニル（例えば、4-ピリミジニル）、ピラジニル（例えば、2-ピラジニル）、シンノリニル（例えば、3-シンノリニル）、フタラジニル（例えば、5-フタラジニル）、キナゾリニル（例えば、2-キナゾリニル）、イソオキサゾリル（例えば、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル）、ベンゾイソオキサゾリル（例えば、1, 2-ベンゾイソオキサゾール-4-イル、2, 1-ベンゾイソオキサゾール-3-イル）、オキサゾリル（例えば、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル）、ベンゾオキサゾリル（例えば、2-ベンゾオキサゾリル）、ベンゾオキサジアゾリル（例えば、4-ベンゾオキサジアゾリル）、イソチアゾリル（例えば、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル）、ベンゾイソチアゾリル（例えば、1, 2-ベンゾイソチアゾール-3-イル、2, 1-ベンゾイソチアゾール-5-イ

ル)、チアゾリル(例えば、2-チアゾリル)、ベンゾチアゾリル(例えば、2-ベンゾチアゾリル)、チアジアゾリル(例えば、1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル)、オキサジアゾリル(例えば、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)、ジヒドロオキサジアゾリル(例えば、4, 5-ジヒドロ-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)、フリル(例えば、2-フリル、3-フリル)、ベンゾフリル(例えば、3-ベンゾフリル)、イソベンゾフリル(例えば、1-イソベンゾフリル)、チエニル(例えば、2-チエニル、3-チエニル)、ベンゾチエニル(例えば、1-ベンゾチオフェン-2-イル、2-ベンゾチオフェン-1-イル)、テトラゾリル(例えば、5-テトラゾリル)、ベンゾジオキソリル(例えば、1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル)、ジベンゾフリル(例えば、2-ジベンゾフリル、3-ジベンゾフリル)、ジベンゾオキセピニル(例えば、ジベンゾ[b, f]オキセピン-2-イル)、ジヒドロジベンゾオキセピニル(例えば、ジヒドロジベンゾ[b, f]オキセピン-2-イル)、クロメニル(例えば、2H-クロメン-3-イル、4H-クロメン-2-イル)、ジベンゾチエピニル(例えば、ジベンゾ[b, f]チエピン-3-イル、ジヒドロジベンゾ[b, f]チエピン-3-イル)、モリホリニル(例えば、1, 4-モルホリン-4-イル)、フェノチアジニル(例えば、2-フェノチアジニル)、シクロペンタチエニル(例えば、シクロペンタ[b]チオフェン-3-イル)、シクロヘキサチエニル(例えば、シクロヘキサ[b]チオフェン-3-イル)等が挙げられる。

「シクロアルキル」とは、 $C_3 \sim C_8$ の環状アルキルを意味し、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等が挙げられる。

「シクロアルケニル」とは、 $C_3 \sim C_8$ の環状アルケニルを意味し、例えば、シクロプロベニル(例えば、1-シクロプロベニル)、シクロブテニル(例えば、2-シクロブテン-1-イル)、シクロペンテニル(1-シクロペンテン-1-イル)、シクロヘキセニル(例えば、1-シクロヘキセン-1-イル)等が挙げられる。

「アルコキシ」とは、 $C_1 \sim C_6$ のアルコキシを意味し、例えば、メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、 i -プロポキシ、 n -ブトキシ等が挙げられる。

「置換もしくは非置換アミノ」における置換アミノとは、例えば、メチルアミ

ノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ、シクロヘキシルアミノ、フェニルアミノ、ジフェニルアミノ等のモノーもしくはジ置換アミノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ等の環状アミノが挙げられる。

「アシルオキシ」とは、前記の「アシル」から誘導されるアシルオキシを意味し、例えば、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、バレリルオキシ等が挙げられる。

「ハロゲン」とは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素を意味する。

「アルコキシカルボニル」とは、前記の「アルコキシ」から誘導されるアルコキシカルボニルを意味し、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、フェニルオキシカルボニル等が挙げられる。

「アラルキルオキシカルボニル」とは、前記の「アラルキル」から誘導されるアラルキルオキシカルボニルを意味し、例えば、ベンジルオキシカルボニル、フェネチルオキシカルボニル等が挙げられる。

「アリールオキシカルボニル」とは、前記の「アリール」から、誘導されるアリールオキシカルボニルを意味し、例えば、フェニルオキシカルボニル、ナフチルオキシカルボニル等が挙げられる。

「アルケニルオキシ」とは、前記の「アルケニル」から、誘導されるアルケニルオキシを意味し、例えば、ビニルオキシ、1-プロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ等が挙げられる。

「ヒドロキシアルキル」とは、前記の「アルキル」から、誘導されるヒドロキシアルキルを意味し、例えば、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル等が挙げられる。

「アルキルチオ」とは、前記の「アルキル」から、誘導されるアルキルチオを意味し、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ等が挙げられる。

「アルキレンジオキシ」とは、 $C_1 \sim C_3$ 、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、プロピレンジオキシ等が挙げられる。

「フェニレン」、「ナフチレン」、「チオフェンジイル」、「インドールジイル」、「オキサゾールジイル」、「オキサジアゾールジイル」、「テトラゾールジイル」においては、置換可能な任意の2箇所で、隣接する基と結合しうる。

また、前記の定義において、置換基が環状のものは、ニトロ、アルコキシ、スルファモイル、置換もしくは非置換アミノ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、ハロゲン、アルキル、アルキニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アラキルオキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、メシルオキシ、シアノ、アルケニルオキシ、ヒドロキシアルキル、トリフルオロメチル、アルキルチオ、 $\text{N}=\text{PPh}_3$ 、オキソ、チオキソ、ヒドロキシイミノ、アルコキシイミノ、フェニルおよびアルキレンジオキシから選ばれる1～3個の基で置換されていてもよいが、環上におけるそれらの置換基は、置換可能な任意の位置で置換していてもよい。

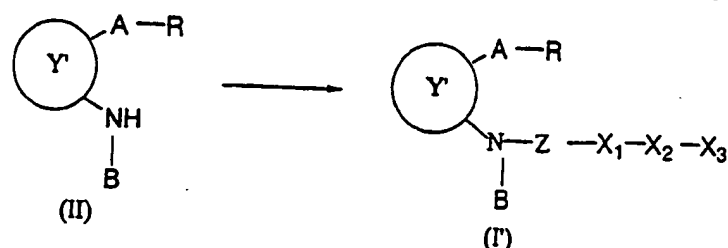
一般式(I)の化合物の塩としては、アルカリ金属塩（例えば、リチウム塩、ナトリウム塩もしくはカリウム塩等）、アルカリ土類金属塩、（例えば、カルシウム塩等）、有機塩基（例えば、トロメタミン、トリメチルアミン、トリエチルアミン、2-アミノブタン、*t*-ブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、*n*-ブチルメチルアミシクロヘキシルアミン、ジシクロヘキシルアミン、*N*-イソプロピルシクロヘキシルアミン、フルフリルアミン、ベンジルアミン、メチルベンジルアミン、ジベンジルアミン、*N*, *N*-ジメチルベンジルアミン、2-クロロベンジルアミン、4-メトキシベンジルアミン、1-ナフチレンメチルアミン、ジフェニルベンジルアミン、トリフェニルアミン、1-ナフチルアミン、1-アミノアントラセン、2-アミノアントラセン、デヒドロアピエチルアミン、*N*-メチルモリホリンもしくはピリジン）との塩、またはアミノ酸塩（例えば、リジン塩もしくはアルギニン塩等）を挙げることができる。

水和物とは、式(I)で示される化合物またはその塩の水和物を意味し、例えば、1水和物、2水和物を挙げることができる。

本発明化合物は、一般式(I)で示され、その全ての立体異性体(ジアステレオマー、エピマー、エナンチオマーなど)又はラセミ体を含む。

一般式(I)で示される化合物の中、 $m=1$ の化合物、とくに、後記の表3bおよび3cに示した化合物は、特開平2-180862明細書に記載された公知化合物である。

化合物] は、下記反応式で示されるごとく、一般式 (I I) で示されるアミノ化合物に部分構造式 $Z-X_1-X_2-X_3$ に対応するスルホン酸またはカルボン酸の反応性誘導体を反応させることにより製造することができる。



(式中、A、B、R、 X_1 、 X_2 、 X_3 、Y および Z は前記と同意義である。)

部分構造式 $Z-X_1-X_2-X_3$ に対応するスルホン酸は一般式 $X_3-X_2-X_1-SO_2OH$ で表される化合物であり、また、カルボン酸とは $X_3-X_2-X_1-COOH$ で表される化合物を意味する。これらスルホン酸またはカルボン酸の反応性誘導体とは、対応する酸ハロゲン化物（例えば、塩化物、臭化物、沃化物）、酸無水物（例えば、ぎ酸もしくは酢酸との混合酸無水物）、活性エステル（例えば、スクシンイミドエステル）などを意味し、通常アミノ基のアシル化に使用するアシル化剤を包含する。また、カルボン酸 $X_3-X_2-X_1-COOH$ は反応性誘導体とはせずに、アミンとカルボン酸の縮合反応に使用する縮合剤（例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド、N,N'-カルボニルジイミダゾール) の存在下に反応させてもよい。

反応は通常のアミノ基のアシル化反応の条件に従って行えばよく、例えば、酸ハロゲン化物による縮合反応の場合、溶媒としてエーテル系溶媒（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、ベンゼン系溶媒（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン）、ハロゲン化炭化水素系溶媒（例えば、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム）、その他、酢酸エチル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリルなどを使用し、要すれば塩基（例えば、トリエチルアミン、ピリジン、N、N-ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリンなどの有機塩基、あるいは水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウムなどの無機塩基）の存在下、冷却下ないし室温あるいは加熱下、好ましくは -20°C ないし氷冷下あるいは室温ないし反応系の加熱還流温度

で、数分ないし数十時間、好ましくは0.5時間ないし24時間、より好ましくは1時間ないし12時間実施すればよい。

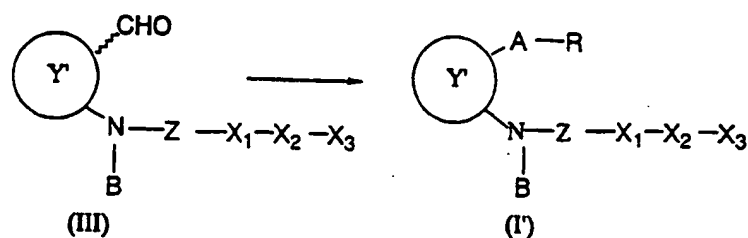
他の反応性誘導体あるいは遊離の酸とアミン(II)との反応においても、各反応性誘導体あるいは遊離酸の性質に応じて、公知の方法に従い、反応条件を定めればよい。

反応生成物は通常の精製法、例えば、溶媒抽出、クロマトグラフィー、再結晶法などにより、精製することができる。

本反応法における原料化合物(II)の具体例を示すと、3-アミノ[2.2.1]ビシクロ環系化合物の具体例としては、7-(3-アミノビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル)-5-ヘプテン酸、7-(3-アミノビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル)-2,2-ジメチル-5-ヘプテン酸、7-(N-メチル-3-アミノビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル)-5-ヘプテン酸、6-(3-アミノビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル)-5-ヘキセン酸等が例示される。また、2-アミノ-6,6-ジメチル[3.1.1]ビシクロ環系化合物の具体例としては、7-(2-アミノ-6,6-ジメチルビシクロ[3.1.1]ヘプト-3-イル)-5-ヘプテン酸等が例示される。また、これら原料化合物のヘプテン酸鎖は飽和となつてヘブタン酸となつてもよいし、-O-、-S-、-NH-等のヘテロ原子もしくはヘテロ基あるいはフェニレンが鎖の途中に介在してもよいし、オキソ基で置換されていてもよく、7-(3-アミノビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル)ヘブタン酸、4-[2-(2-アミノビシクロ[3.1.1]ヘプト-3-イル)エトキシフェニル酢酸、7-(3-アミノビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル)-6-オキソヘブタン酸等が例示される。これらの原料化合物は、特公平5-79060号明細書、特公平6-23170号明細書に記載された公知化合物であるか、あるいはこれらの明細書に記載の方法に従って製造することができる。

ン酸またはカルボン酸、アリールスルホン酸またはカルボン酸、アラルキルオキシスルホン酸またはカルボン酸、ヘテロ環置換スルホン酸またはカルボン酸、ヘテロアリーラルキルスルホン酸またはカルボン酸、および置換アミノスルホン酸またはカルボン酸である。これらのスルホン酸およびカルボン酸は、それぞれ前記定義の置換基を有することができる。また、これらのスルホン酸およびカルボン酸は、市販品として入手可能であるか、あるいは既知の化合物から既知の方法に従って容易に合成できるものである。反応に際し、これらのスルホン酸およびカルボン酸は、必要に応じて、対応する上記の反応性誘導体とすることができる。例えば、酸ハロゲン化物とするときは、ハロゲン化チオニル(例えば、塩化チオニル)、ハロゲン化リン(例えば、三塩化リン、五塩化リン)、ハロゲン化オギザリル(例えば、塩化オギザリル)等と公知の方法(例えば、新実験化学講座 14巻 1787頁(1978); Synthesis 852-854(1986); 新実験化学講座 22巻 115頁(1992))に従って反応させればよい。他の反応性誘導体についても同様に公知の方法で調製することができる。

本発明目的化合物(I)の中、側鎖Aが不飽和結合、特に二重結合を有する化合物は、下記一般式(III)で表わされるアルデヒド誘導体に、側鎖A-R部分の残余部分に対応するイリド化合物をウィティッヒ(Wittig)反応の条件に従って反応させ製造することもできる。



(式中、A、B、R、X₁、X₂、X₃、YおよびZは前記と同意義である。)

原料化合物(III)は、例えば、特開平2-256650号明細書に記載の方法に従って製造することができる。また、側鎖A-R部分の残余部分に対応するイリド化合物は、対応するハロゲン化アルカン酸もしくはそのエステル誘導体、エーテル誘導体、アミド誘導体等とトリフェニルホスフィンとを塩基の存在下、公知の方法に従い反応させ合成することができる。

本発明目的化合物(I)においてRがCOOHである化合物は、所望により、

対応するエステル誘導体、アルコール誘導体、エーテル誘導体、アミド誘導体とすることもできる。例えば、エステル誘導体はカルボン酸を公知の方法に従いエステル化することにより製造することができる。また、エステル誘導体を還元すればアルコール誘導体とすることができるし、アミド化すればアミド誘導体とすることもできる。エーテル誘導体はアルコール誘導体を O-アルキル化することによっても製造することができる。

本発明の化合物 (I) はインビトロで PGD_2 受容体と結合することによる PGD_2 拮抗作用を示し、 PGD_2 の生産過多に起因する肥満細胞機能不全に関連した疾患の治療剤として有用である。例えば全身性肥満細胞症や全身性肥満細胞活性化障害の治療剤、抗気管収縮剤、抗喘息剤、抗アレルギー性鼻炎剤、抗アレルギー性結膜炎剤、抗蕁麻疹剤、虚血再灌流傷害治療薬、抗炎症剤として用いることができる。特に、本発明化合物 (I) は、インビボで鼻閉抑制作用を示すことから、鼻閉症の治療剤として有用である。

本発明の化合物 (I) を治療に用いるには、通常の経口又は非経口投与用の製剤として製剤化する。本発明の化合物 (I) を含有する医薬組成物は、経口及び非経口投与のための剤形をとることができる。即ち、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、シロップ剤などの経口投与製剤、あるいは、静脈注射、筋肉注射、皮下注射などの注射用溶液又は懸濁液、吸入薬、点眼薬、点鼻薬、坐剤、もしくは軟膏剤などの経皮投与用製剤などの非経口製剤とすることもできる。

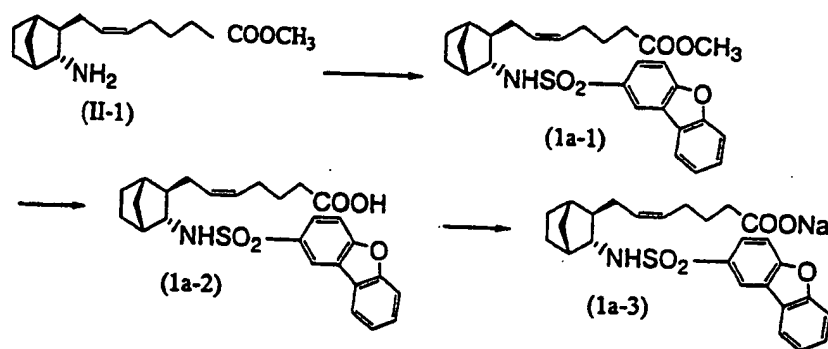
これらの製剤は当業者既知の適当な担体、賦形剤、溶媒、基剤等を用いて製造することができる。例えば、錠剤の場合、活性成分と補助成分を一緒に圧縮又は成型する。補助成分としては、製剤的に許容される賦形剤、例えば結合剤 (例、トウモロコシでん粉)、充填剤 (例、ラクトース、微結晶性セルロース)、崩壊剤 (例、でん粉グリコール酸ナトリウム) 又は滑沢剤 (例、ステアリン酸マグネシウム) などが用いられる。錠剤は、適宜、コーティングしてもよい。シロップ

器に適応可能な液剤として、点眼剤として使用する場合は液剤又は懸濁化剤として用いる。特に鼻閉症治療のための点鼻薬として用いる場合、通常の製剤化の方法に従って、液剤、懸濁化剤として用いるか、あるいは粉末化剤（例、ヒドロキシプロピルセルロース、カーボボール）等を加え、粉末剤として鼻孔に加える。あるいは、低沸点の溶媒とともに特殊な容器に充填し、噴射剤として用いることができる。

化合物（I）の投与量は、投与形態、患者の症状、年齢、体重、性別、あるいは併用される薬物（あるとすれば）などにより異なり、最終的には医師の判断に委ねられるが、経口投与の場合、体重1 kgあたり、1日0.01～100 mg、好ましくは0.01～10 mg、より好ましくは0.1～10 mg、非経口投与の場合、体重1 kgあたり、1日0.001～100 mg、好ましくは0.001～1 mg、より好ましくは0.01～1 mgを投与する。これを1～4回に分割して投与すればよい。

以下に実施例を挙げて本発明を詳しく説明するが、これらは単なる例示であり本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例 1



窒素気流下、(Z)－7－[(1S, 2R, 3R, 4R)－3－アミノビシクロ[2.2.1]ヘプト－2－イル]－5－ヘプテン酸メチル（II－1）（251 mg, 1.00 mmol）を塩化メチレン（8 ml）に溶解し、トリエチルアミン（0.238 ml, 2.00 mmol）を加えた後、氷冷下、2－クロロスルフォニルジベンゾフラン（350 mg, 1.31 mmol）を加え30分攪拌し、室温まで昇温した。反応液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン-酢酸エチル1：4）で精製し、n-ヘキサン（10 ml）より結晶化して、(Z)－7－[(1S, 2R, 3R,

4 R) — 3 — (2-ジベンゾフリル) スルホニルアミノピシクロ [2. 2. 1] ヘプト-2-イル] — 5-ヘプテン酸メチル (1 a-1) (342 mg, 0.710 mmol)を得た。収率 71%。

融点: 115-116°C

元素分析 (C₂₇H₃₁NO₃Sとして)

計算値 (%) : C, 67.34; H, 6.49; N, 2.91; S, 6.66

実測値 (%) : C, 67.16; H, 6.47; N, 2.99; S, 6.66

IR (CHCl₃) : 3382, 3024, 2952, 2874, 1726, 1583, 1465, 1442, 1319, 1245, 1154, 1121, 1104, 1071, 1019, 890, 840, 817 /cm.

¹H NMR(CDCl₃) δ : 0.94-1.92(14H, m), 2.15-2.24(3H, m), 2.99-3.07(1H, m), 3.66(3H, s), 4.98(1H, d, J=6.6 Hz), 5.10-5.22(2H, m), 7.39-7.46(1H, m), 7.51-7.70(3H, m), 7.87-8.13(2H, m), 8.53(1H, d, J=2.1 Hz).

[α]_D = -0.6° (CHCl₃, c=1.01%, 23°C).

([α]₃₆₅ = +37.0° (CHCl₃, c=1.01%, 23°C).

(Z) — 7 — [(1 S, 2 R, 3 R, 4 R) — 3 — (2-ジベンゾフリル) スルホニルアミノピシクロ [2. 2. 1] ヘプト-2-イル] — 5-ヘプテン酸メチル (1 a-1) (234 mg, 0.50 mmol)をメタノール(6 ml) — テトラヒドロフラン(4 ml)に溶解し、氷冷下 1 N水酸化カリウム(1.50 ml, 1.50 mmol)を加えた後、室温まで昇温し、16時間反応させた。溶媒を溜去した後、残渣に酢酸エチル(50 ml)と水(10 ml)を加え、さらに 1 N塩酸(2.00 ml, 2.00 mmol)を加え、有機層を分取した。有機層を飽和食塩水で洗った後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を溜去した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン-酢酸エチル = 1 : 1, 0.2% 酢酸) で精製し、(Z) — 7

,1153,1121,1104,1072,906 /cm.

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93-1.94(14H,m), 2.12-2.19(1H,m), 2.26(2H,t, $J=7.2\text{ Hz}$), 3.00-3.08(1H,m), 5.12-5.25(2H,m), 5.26(1H,d, $J=6.6\text{ Hz}$), 7.38-7.45(1H,m), 7.51-7.70(3H,m), 7.87-8.13(2H,m), 8.54(1H,d, $J=2.1\text{ Hz}$).

$[\alpha]_D = +6.8^\circ$ (CHCl_3 , $c=1.08\%$, 23°C).

(Z)-7-[(1S, 2R, 3R, 4R)-3-(2-ジベンゾフリル)スルホニルアミノピシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル]-5-ヘプテン酸 (1a-2) (453 mg, 0.97 mmol) をメタノール(5 ml) に溶解し、氷冷下 1 N ナトリウムメトキシド/メタノール溶液(1.034 規定, 0.937 ml, 0.97 mmol) を加えた後、室温まで昇温し、1 時間反応させた。溶媒を溜去して、ナトリウム塩 (1a-3) (457 mg, 0.933 mmol) を得た。収率 96%。

無晶状粉末

元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{28}\text{NO}_5\text{SNa} \cdot 0.6\text{H}_2\text{O}$ として)

計算値 (%) : C, 62.41; H, 5.88; N, 2.80; S, 6.41; Na, 4.59

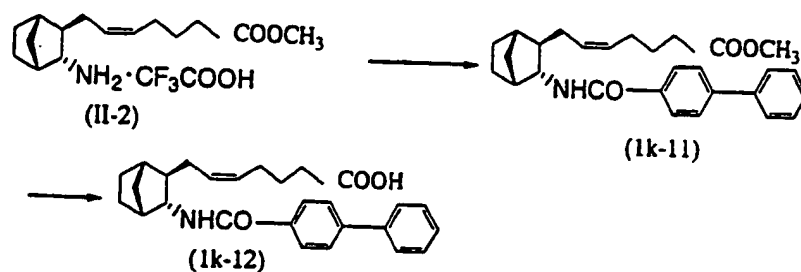
実測値 (%) : C, 62.45; H, 5.92; N, 2.99; S, 6.49; Na, 4.46

IR (KBr) : 3434, 3280, 3074, 3007, 2952, 2873, 1566, 1467, 1444, 1417, 1344, 1315, 1270, 1248, 1200, 1189, 1154, 1124, 1107, 1075, 1058, 895, 842, 818 /cm.

$^1\text{H NMR}(\text{CD}_3\text{OD}) \delta$: 1.02-2.05(16H,m), 2.16-2.23(1H,m), 2.94-3.00(1H,m), 4.98-5.05(2H,m), 7.41-7.48(1H,m), 7.53-7.62(1H,m), 7.66(1H,d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.77(1H,d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.57(1H,d, $J=2.1\text{ Hz}$).

$[\alpha]_D = -15.2^\circ$ (CH_3OH , $c=1.07\%$, 22°C).

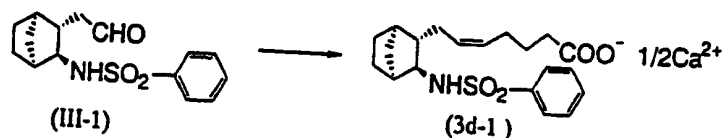
実施例 2



(Z)－7－[(1S, 2R, 3R, 4R)－3－アミノビシクロ[2.2.1]ヘプト－2－イル]－5－ヘプテン酸メチル トリフルオロ酢酸塩 (I I－2) (特公平5－79060号、参考例4に準じて製造) 232 mg (0.636 mmol) を塩化メチレン (5 ml) に溶解し、氷冷下、トリエチルアミン 0.279 ml (2.0 mmol) と4－ビフェニルカルボニルクロリドを加え、同温度で7時間攪拌する。反応液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル：ヘキサン＝1：4) で精製し、(Z)－7－[(1S, 2R, 3R, 4R)－3－(4－ビフェニル)カルボニルアミノビシクロ[2.2.1]ヘプト－2－イル]－5－ヘプテン酸メチル (1k－11) 221 mg (0.512 mmol) を得た。この化合物 (1k－11) (190 mg, 0.440 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、氷冷下 1N KOH (1.10 ml, 1.10 mmol) を加え室温で15時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮した後、残渣に水 (20 ml) と 1N HCl (2 ml) を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗った後硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル：ヘキサン＝1：1) (0.3% 酢酸) で精製して (Z)－7－[(1S, 2R, 3R, 4R)－3－(4－ビフェニル)カルボニルアミノビシクロ[2.2.1]ヘプト－2－イル]－5－ヘプテン酸 (1k－12) 172 mg (0.412 mmol) を得た。収率 94%。

下記に示す化合物は、以下の方法でも製造できる。

実施例 3



窒素雰囲気下、4－カルボキシブチルトリフェニルホスホニウムブロマイド (14.8 g, 33.3 mmol) およびテトラヒドロフラン (80 ml) から成る懸濁液にカリウムt－ブチレート (7.55 g, 67.3 mmol) を室温で加える。室温のまま1時間攪拌した後、－20℃に冷却してN－[(1S, 2S, 3S, 4R)－3－ホルミルメチルビシクロ[2.2.1]ヘプト－2－イル]ベンゼンスルホンアミ

ド (I I I-1) (特開平 2-256650 号、参考例 2) (3.25 g, 11.1 mmol) のテトラヒドロフラン溶液 (20 ml) をゆっくり加える。-20℃ で約 1 時間半撈拌を続けた後、氷浴を除き、更に 1 時間撈拌する。反応液に 2 N 塩酸を加え酢酸エチルで抽出し、水及び食塩水で洗浄後濃縮する。得られた粗生成物にトルエンと 1 N 水酸化ナトリウム溶液を加えて水層を分取する。有機層をもう一度水洗し、先程の水層と合わせた後、2 N 塩酸を加える。酢酸エチルで抽出後、水及び食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後濃縮する。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、(Z)-7-[(1R, 2S, 3S, 4S)-3-フェニルスルホニルアミノピシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル]-5-ヘプテン酸カルシウム (1d-1) を得る (3.29 g, 収率 79%)。

融点: 62℃

元素分析 (C₂₀H₂₇NO₄S として)

計算値(%): C, 63.63; H, 7.21; N, 3.71; S, 8.49

実測値(%): C, 63.56; H, 7.21; N, 3.83; S, 8.43

$[\alpha]_D^{25} = +5.3 \pm 0.5^\circ$ (CHCl₃, C=1.003%, 22℃)

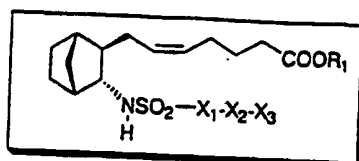
$[\alpha]_D^{25} = +27.1 \pm 0.7^\circ$ (MeOH, C=1.015%, 24℃)

IR (Nujol) 3282, 3260, 3300, 2400, 1708, 1268, 1248, 1202, 1162, 1153, 1095, 1076/cm

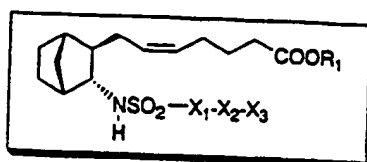
¹H NMR δ 0.88-2.10(m, 14H), 2.14(br s, 1H), 2.34(t, J=7.2Hz, 2H), 2.95-3.07(m, 1H), 5.13-5.35(m, 3H), 7.45-7.64(m, 3H), 7.85-7.94(m, 2H), 9.52(br s, 1H)

上記実施例と同様にして製造した化合物を以下に示す。

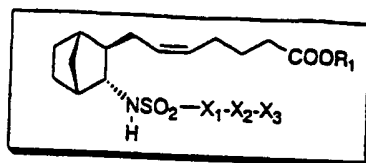
表 1a



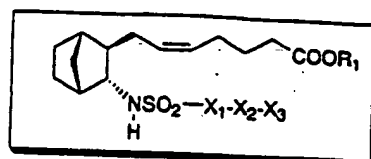
No.	R_1	$X_1-X_2-X_3$
1a-1	CH_3	
1a-2	H	
1a-3	Na	
1a-4	CH_3	
1a-5	H	
1a-6	CH_3	
1a-7	H	
1a-8	CH_3	
1a-9	H	
1a-10	CH_3	
1a-11	H	
1a-12	CH_3	
1a-13	H	
1a-14	CH_3	
1a-15	H	
1a-16	CH_3	
1a-17	H	
1a-18	CH_3	
1a-19	H	
1a-20	CH_3	
1a-21	H	
1a-22	H	
1a-23	H	



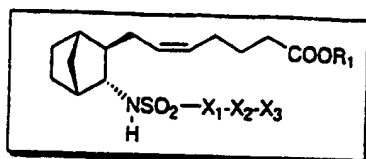
No.	R ₁	X ₁ –X ₂ –X ₃
1a-24	CH ₃	
1a-25	H	
1a-26	Na	
1a-27	CH ₃	
1a-28	H	
1a-29	Na	
1a-30	CH ₃	
1a-31	H	
1a-32	CH ₃	
1a-33	H	
1a-34	CH ₃	
1a-35	CH ₃	
1a-36	H	
1a-37	CH ₃	
1a-38	H	
1a-39	CH ₃	
1a-40	H	
1a-41	H	
1a-42	CH ₃	
1a-43	H	
1a-44	CH ₃	
1a-45	H	



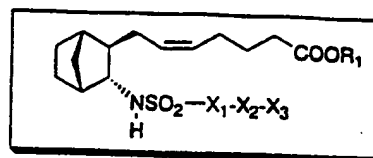
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1a-46	CH ₃	
1a-47	H	
1a-48	Na	
1a-49	CH ₃	
1a-50	H	
1a-51	CH ₃	
1a-52	H	
1a-53	CH ₃	
1a-54	H	
1a-55	CH ₃	
1a-56	H	
1a-57	CH ₃	
1a-58	H	
1a-59	CH ₃	
1a-60	H	
1a-61	CH ₃	
1a-62	H	
1a-63	CH ₃	
1a-64	H	
1a-65	CH ₃	
1a-66	H	
1a-67	CH ₃	
1a-68	H	



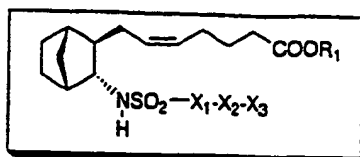
No.	R_1	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
1a-69	CH_3	
1a-70	H	
1a-71	CH_3	
1a-72	H	
1a-73	CH_3	
1a-74	H	
1a-75	CH_3	
1a-76	H	
1a-77	CH_3	
1a-78	H	
1a-79	H	
1a-80	CH_3	
1a-81	H	
1a-82	CH_3	
1a-83	H	
1a-84	H	
1a-85	H	
1a-86	H	
1a-87	H	



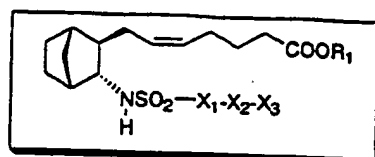
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1a-88	CH ₃	
1a-89	H	
1a-90	CH ₃	
1a-91	H	
1a-92	CH ₃	
1a-93	H	
1a-94	H	
1a-95	H	
1a-96	H	
1a-97	H	
1a-98	H	
1a-99	Na	



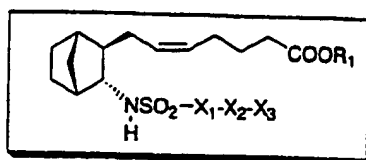
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1a-100	CH ₃	
1a-101	H	
1a-102	CH ₃	
1a-103	CH ₃	
1a-104	H	
1a-105	CH ₃	
1a-106	H	
1a-107	CH ₃	
1a-108	H	
1a-109	CH ₃	
1a-110	H	
1a-111	CH ₃	
1a-112	H	
1a-113	CH ₃	
1a-114	H	



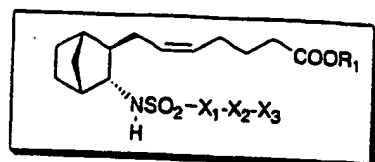
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1a-115	CH ₃	
1a-116	H	
1a-117	Na	
1a-118	iPr	
1a-119	CH ₃	
1a-120	Na	
1a-121	H	
1a-122	CH ₃	
1a-123	H	
1a-124	CH ₃	
1a-125	CH ₃	
1a-126	H	
1a-127	CH ₃	
1a-128	H	
1a-129	CH ₃	
1a-130	CH ₃	
1a-131	H	
1a-132	CH ₃	
1a-133	H	
1a-134	H	
1a-135	CH ₃	
1a-136	H	
1a-137	CH ₃	
1a-138	H	
1a-139	CH ₃	
1a-140	H	



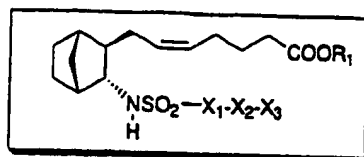
No.	R_1	$\text{X}_1\text{--X}_2\text{--X}_3$
1a-141 1a-142	CH_3 H	$\text{--CH}_2\text{--}$
1a-143	H	
1a-144	H	
1a-145	H	
1a-146	H	
1a-147	H	
1a-148	H	
1a-149	H	
1a-150	H	
1a-151	H	



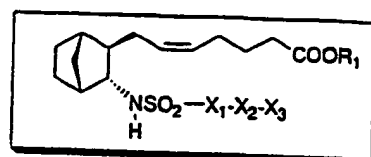
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1a-152	H	
1a-153	H	
1a-154	H	
1a-155	H	
1a-156	H	
1a-157	H	
1a-158	H	
1a-159	H	
1a-160	H	



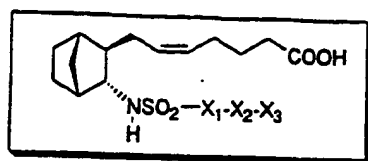
No.	R_1	$X_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
1a-161	H	
1a-162	H	
1a-163	H	
1a-164	H	
1a-165	H	
1a-166	H	
1a-167	H	
1a-168	H	
1a-169	H	
1a-170	H	
1a-171	CH_3	
1a-172	H	



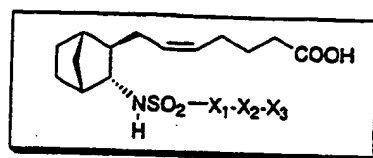
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1a-173	H	
1a-174	H	
1a-175	CH ₃	
1a-176	H	
1a-177	CH ₃	
1a-178	H	
1a-179	CH ₃	
1a-180	H	
1a-181	H	
1a-182	CH ₃	
1a-183	H	



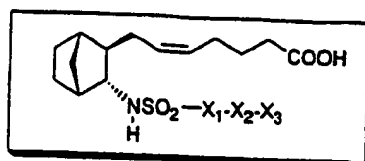
No.	R_1	$X_1\text{--}X_2\text{--}X_3$
1a-184	H	
1a-185	H	
1a-186	CH_3	
1a-187	H	
1a-188	CH_3	
1a-189	H	
1a-190	CH_3	
1a-191	H	
1a-192	CH_3	
1a-193	H	



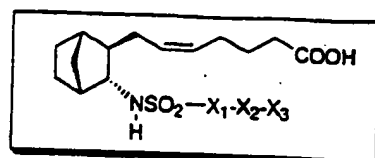
No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
1a-194	
1a-195	
1a-196	
1a-197	
1a-198	
1a-199	
1a-200	
1a-0201	
1a-202	
1a-203	



No.	$\text{X}_1\text{--X}_2\text{--X}_3$
1a-204	
1a-205	
1a-206	
1a-207	
1a-208	
1a-209	
1a-210	
1a-211	
1a-212	
1a-213	



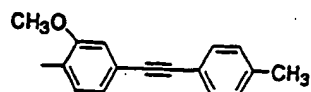
No.	X ₁ -X ₂ -X ₃
1a-214	
1a-215	
1a-216	
1a-217	
1a-218	
1a-219	
1a-220	
1a-221	
1a-222	
1a-223	



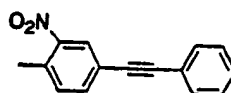
No.

 $\text{X}_1\text{--X}_2\text{--X}_3$

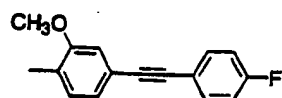
1a-224



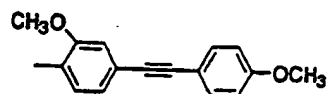
1a-225



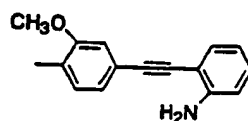
1a-226



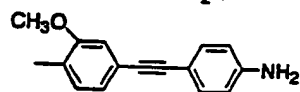
1a-227



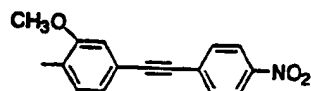
1a-228



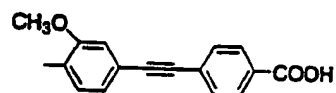
1a-229



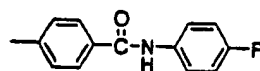
1a-230



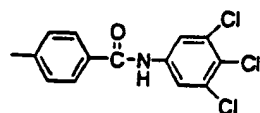
1a-231



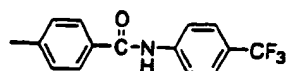
1a-232



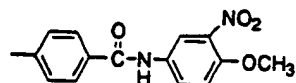
1a-233

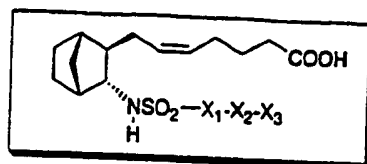


1a-234



1a-235

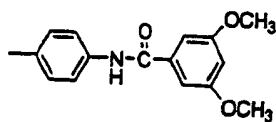




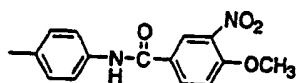
No.

$X_1-X_2-X_3$

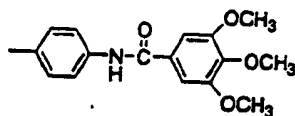
1a-236



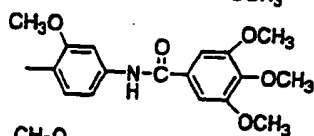
1a-237



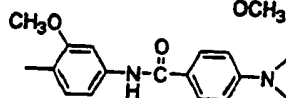
1a-238



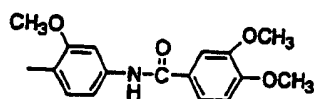
1a-239



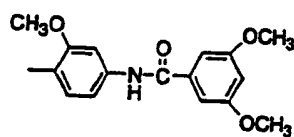
1a-240



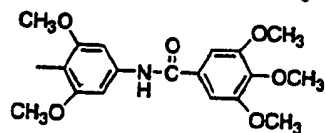
1a-241



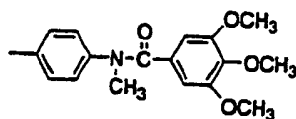
1a-242



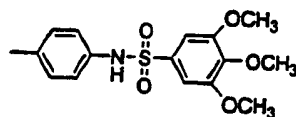
1a-243



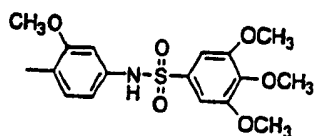
1a-244

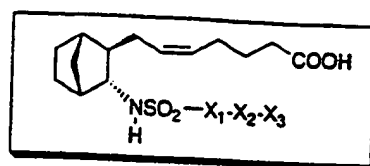


1a-245



1a-246

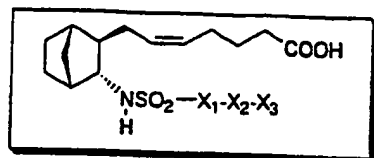




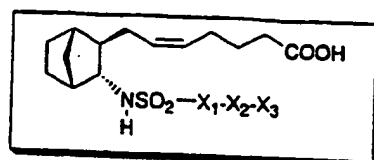
No.

 $\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$

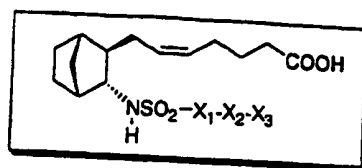
1a-247	
1a-248	
1a-249	
1a-250	
1a-251	
1a-252	
1a-253	
1a-254	
1a-255	
1a-256	
1a-257	



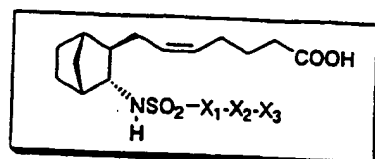
No.	$X_1-X_2-X_3$
1a-258	
1a-259	
1a-260	
1a-261	
1a-262	
1a-263	
1a-264	
1a-265	
1a-266	
1a-267	
1a-268	
1a-269	
1a-270	
1a-271	



No.	X ₁ -X ₂ -X ₃
1a-272	
1a-273	
1a-274	
1a-275	
1a-276	
1a-277	
1a-278	
1a-279	
1a-280	
1a-281	
1a-282	
1a-283	

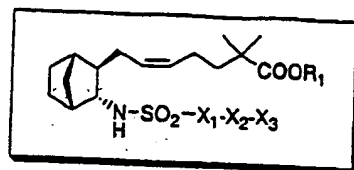


No.	X ₁ -X ₂ -X ₃
1a-284	
1a-285	
1a-286	
1a-287	
1a-288	
1a-289	
1a-290	
1a-291	
1a-292	
1a-293	
1a-294	

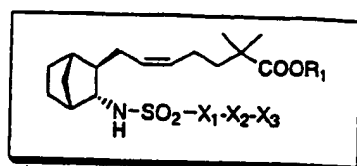


No.	$X_1-X_2-X_3$
1a-295	
1a-296	
1a-297	
1a-298	
1a-299	
1a-300	
1a-301	
1a-302	
1a-303	
1a-304	
1a-305	

表 1 b

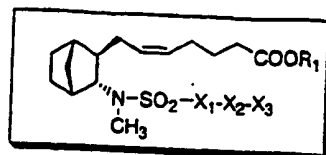


No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1b-1	CH ₃	
1b-2	CH ₃	
1b-3	H	
1b-4	H	
1b-5	H	
1b-6	H	
1b-7	H	
1b-8	H	
1b-9	H	
1b-10	H	



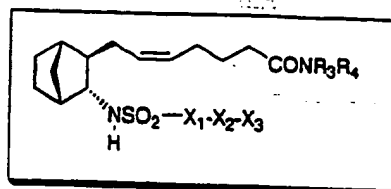
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1b-11	H	
1b-12	H	
1b-13	H	
1b-14	H	
1b-15	H	

表 1c

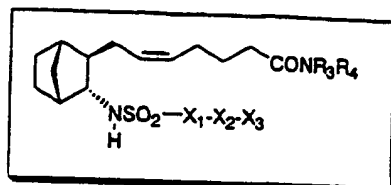


No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1c-1	CH ₃	
1c-2	CH ₃	
1c-3	K	
1c-4	H	
1c-5	H	
1c-6	H	
1c-7	H	
1c-8	H	
1c-9	H	
1c-10	H	
1c-11	H	
1c-12	H	

表 1 d

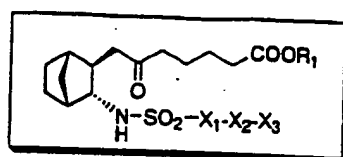


No.	R ₃	R ₄	X ₁ -X ₂ -X ₃
1d-1	H	SO ₂ CH ₃	
1d-2	H	H	
1d-3	H	OH	
1d-4	H	SO ₂ CH ₃	
1d-5	H	SO ₂ CH ₃	
1d-6	H	SO ₂ CH ₃	
1d-7	H	SO ₂ CH ₃	
1d-8	H	SO ₂ CH ₃	
1d-9	H	SO ₂ CH ₃	
1d-10	H	SO ₂ CH ₃	



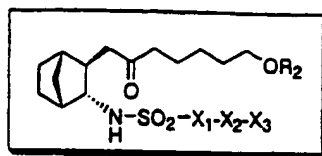
No.	R ₃	R ₄	X ₁ -X ₂ -X ₃
1d-11	H	SO ₂ CH ₃	
1d-12	H	SO ₂ CH ₃	
1d-13	H	SO ₂ CH ₃	
1d-14	H	SO ₂ CH ₃	
1d-15	H	SO ₂ CH ₃	

表 1e



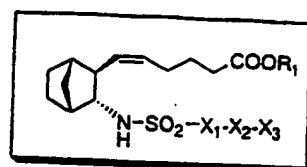
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1e-1	H	
1e-2	H	
1e-3	H	
1e-4	H	
1e-5	H	
1e-6	H	
1e-7	H	
1e-8	H	
1e-9	H	
1e-10	H	

表 1f



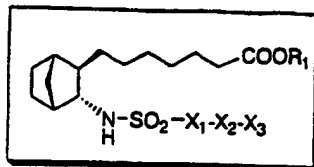
No.	R ₂	X ₁ -X ₂ -X ₃
1f-1	H	
1f-2	H	
1f-3	H	
1f-4	H	
1f-5	H	
1f-6	H	
1f-7	H	
1f-8	H	
1f-9	H	
1f-10	H	

表 1g



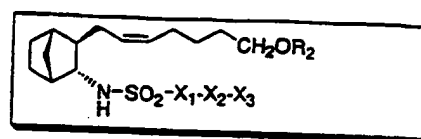
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1g-1	H	
1g-2	H	
1g-3	H	
1g-4	H	
1g-5	H	
1g-6	H	
1g-7	H	
1g-8	H	
1g-9	H	
1g-10	H	
1g-11	H	

表 I h



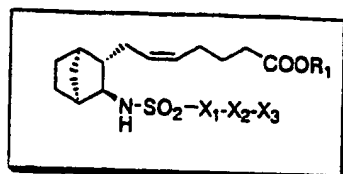
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1h-1	H	
1h-2	H	
1h-3	H	
1h-4	H	
1h-5	H	
1h-6	H	
1h-7	H	
1h-8	H	
1h-9	H	
1h-10	H	

表 11

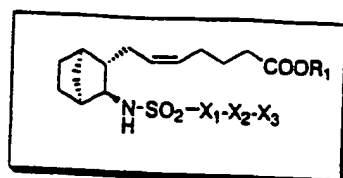


No.	R ₂	X ₁ -X ₂ -X ₃
1i-1	H	
1i-2	H	
1i-3	H	
1i-4	H	
1i-5	H	
1i-6	H	
1i-7	H	
1i-8	H	
1i-9	H	
1i-10	H	
1i-11	H	
1i-12	H	

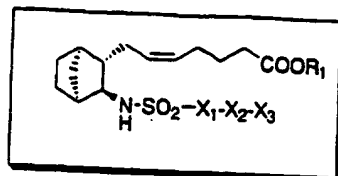
表 1j



No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1j-1	CH ₃	
1j-2	H	
1j-3	Na	
1j-4	H	
1j-5	CH ₃	
1j-6	CH ₃	
1j-7	H	
1j-8	CH ₃	
1j-9	CH ₃	
1j-10	H	
1j-11	CH ₃	
1j-12	H	
1j-13	CH ₃	
1j-14	H	
1j-15	CH ₃	
1j-16	H	

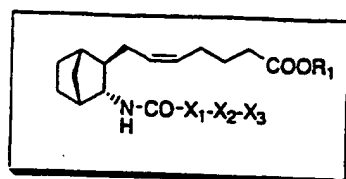


No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1j-17	H	
1j-18	CH ₃	
1j-19	H	
1j-20	CH ₃	
1j-21	H	
1j-22	H	
1j-23	CH ₃	
1j-24	H	
1j-25	CH ₃	
1j-26	H	
1j-27	H	
1j-28	CH ₃	
1j-29	H	

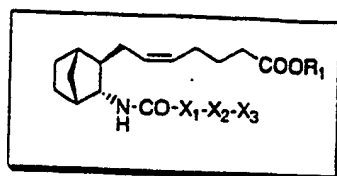


No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1j-30	H	
1j-31	H	
1j-32	H	
1j-33	H	
1j-34	H	
1j-35	H	
1j-36	H	
1j-37	H	
1j-38	H	

表 1k

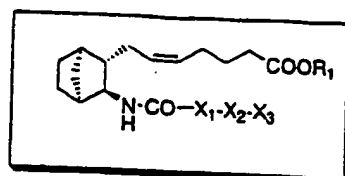


No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1k-1	H	
1k-2	CH ₃	
1k-3	H	
1k-4	H	
1k-5	H	
1k-6	H	
1k-7	H	
1k-8	H	
1k-9	H	
1k-10	H	
1k-11	CH ₃	
1k-12	H	

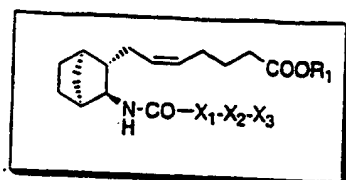


No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1k-13	H	
1k-14	H	
1k-15	H	
1k-16	H	
1k-17	H	
1k-18	H	
1k-19	H	
1k-20	H	

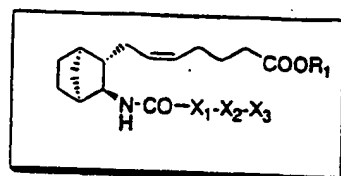
表 1



No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1m-1 1m-2	CH ₃ H	
1m-3 1m-4	CH ₃ H	
1m-5 1m-6	CH ₃ H	
1m-7 1m-8	CH ₃ H	
1m-9 1m-10	CH ₃ H	
1m-11 1m-12	CH ₃ H	
1m-13 1m-14	CH ₃ H	
1m-15 1m-16	CH ₃ H	
1m-17 1m-18	CH ₃ H	

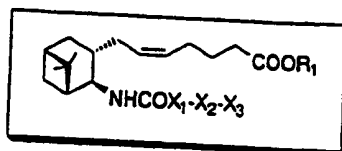


No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1m-19	CH ₃	
1m-20	H	
1m-21	H	
1m-22	H	
1m-23	CH ₃	
1m-24	H	
1m-25	CH ₃	
1m-26	H	
1m-27	CH ₃	
1m-28	H	
1m-29	CH ₃	
1m-30	H	
1m-31	H	
1m-32	H	
1m-33	H	

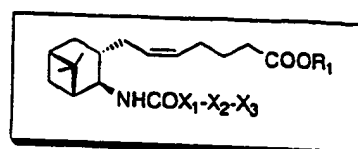


No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
1m-34	H	
1m-35	H	
1m-36	H	
1m-37	H	
1m-38	H	
1m-39	H	
1m-40	H	

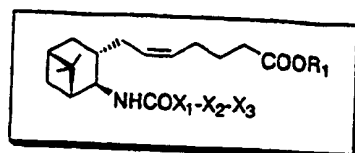
表 2a



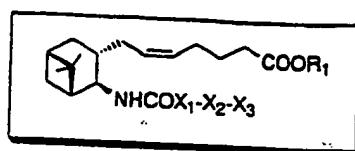
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-1	CH ₃	
2a-2	H	
2a-3	CH ₃	
2a-4	H	
2a-5	Na	
2a-6	CH ₃	
2a-7	H	
2a-8	CH ₃	
2a-9	H	
2a-10	CH ₃	
2a-11	H	
2a-12	CH ₃	
2a-13	H	
2a-14	CH ₃	
2a-15	H	
2a-16	CH ₃	
2a-17	H	
2a-18	CH ₃	
2a-19	H	
2a-20	CH ₃	
2a-21	H	
2a-22	Na	
2a-23	CH ₃	
2a-24	H	



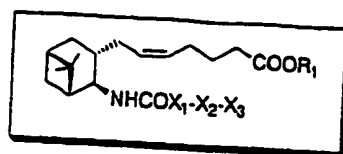
No.	R_1	$X_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-25	CH_3	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-26	H	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-27	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-28	H	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-29	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{O}-\text{C}_6\text{H}_5)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-30	H	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{O}-\text{C}_6\text{H}_5)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-31	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{N}-\text{C}_6\text{H}_5)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-32	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{C}_6\text{H}_5)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-33	H	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{C}_6\text{H}_5)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-34	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}\equiv\text{C}-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-35	H	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}\equiv\text{C}-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-36	CH_3	$-\text{N}(\text{C}_6\text{H}_5)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-37	H	$-\text{N}(\text{C}_6\text{H}_5)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-38	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{OH})-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-39	H	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{OH})-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-40	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{NH}_2)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-41	H	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{NH}_2)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-42	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{NH}_2)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-43	H	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{NH}_2)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-44	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{NH}_2)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-45	H	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{NH}_2)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-46	CH_3	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{NH}_2)-\text{C}_6\text{H}_5$
2a-47	H	$-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{NH}_2)-\text{C}_6\text{H}_5$



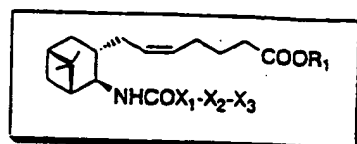
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-48	CH ₃	
2a-49	H	
2a-50	CH ₃	
2a-51	H	
2a-52	CH ₃	
2a-53	H	
2a-54	CH ₃	
2a-55	H	
2a-56	CH ₃	
2a-57	H	
2a-58	CH ₃	
2a-59	H	
2a-60	CH ₃	
2a-61	H	
2a-62	CH ₃	
2a-63	H	
2a-64	CH ₃	
2a-65	H	
2a-66	CH ₃	
2a-67	H	



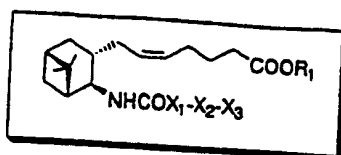
No.	R_1	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-68	CH_3	
2a-69	H	
2a-70	CH_3	
2a-71	H	
2a-72	CH_3	
2a-73	H	
2a-74	CH_3	
2a-75	H	
2a-76	CH_3	
2a-77	H	
2a-78	CH_3	
2a-79	H	
2a-80	CH_3	
2a-81	H	
2a-82	CH_3	
2a-83	H	
2a-84	CH_3	
2a-85	H	
2a-86	CH_3	
2a-87	H	



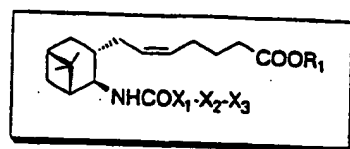
No.	R_1	$X_1-X_2-X_3$
2a-88	CH_3	
2a-89	H	
2a-90	CH_3	
2a-91	H	
2a-92	CH_3	
2a-93	H	
2a-94	CH_3	
2a-95	H	
2a-96	Na	
2a-97	$\text{Ca}^{1/2}$	
2a-98	CH_3	
2a-99	H	
2a-100	CH_3	
2a-101	H	
2a-102	CH_3	
2a-103	H	
2a-104	CH_3	
2a-105	H	
2a-106	CH_3	
2a-107	H	
2a-108	CH_3	
2a-109	H	
2a-110	Na	
2a-111	CH_3	
2a-112	H	



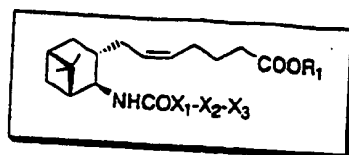
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-113	CH ₃	
2a-114	H	
2a-115	CH ₃	
2a-116	H	
2a-117	CH ₃	
2a-118	H	
2a-119	H	
2a-120	H	
2a-121	H	
2a-122	H	
2a-123	H	
2a-124	H	
2a-125	H	

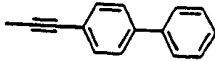
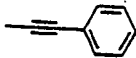




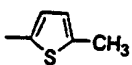
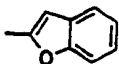
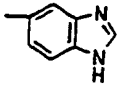
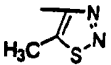

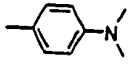


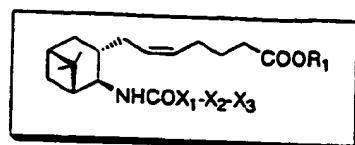
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-126	H	
2a-127	H	
2a-128	H	
2a-129	H	
2a-130	H	
2a-131	H	
2a-132	H	
2a-133	H	
2a-134	H	
2a-135	H	
2a-136	H	



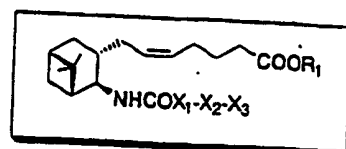
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-137	H	
2a-138	H	
2a-139	H	
2a-140	H	
2a-141	H	
2a-142	H	
2a-143	H	
2a-144	H	
2a-145	H	
2a-146	H	
2a-147	H	



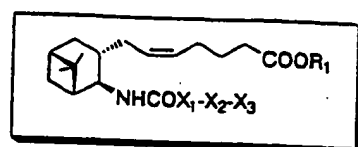
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-148	H	
2a-149	H	
2a-150	H	
2a-151	H	
2a-152	H	
2a-153	H	
2a-154	H	
2a-155	H	
2a-156	H	
2a-157	H	
2a-158	H	
2a-159	H	



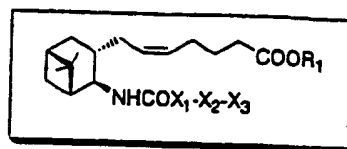
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-160	H	
2a-161	H	
2a-162	H	
2a-163	H	
2a-164	H	
2a-165	H	
2a-166	H	
2a-167	H	
2a-168	H	
2a-169	H	
2a-170	H	



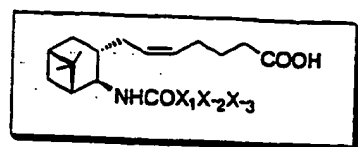
No.	R_1	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-171	H	
2a-172	H	
2a-173	H	
2a-174	H	
2a-175	H	
2a-176	H	
2a-177	H	
2a-178	H	
2a-179	H	
2a-180	H	
2a-181	H	
2a-182	H	



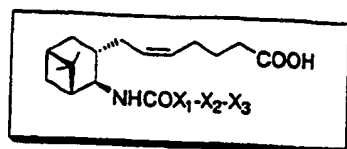
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-183	H	
2a-184	H	
2a-185	H	
2a-186	H	
2a-187	H	
2a-188	H	
2a-189	H	
2a-190	H	
2a-191	H	
2a-192	H	
2a-193	H	



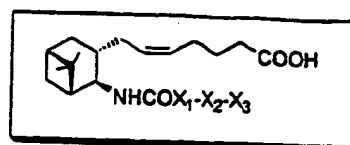
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-194	H	
2a-195	H	
2a-196	H	
2a-197	H	
2a-198	H	
2a-199	H	
2a-200	H	
2a-201	H	
2a-202	H	
2a-203	H	

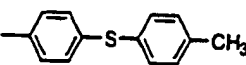
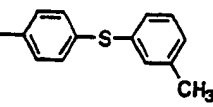
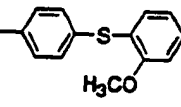
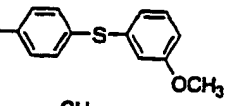
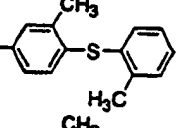
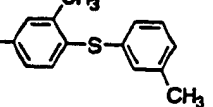
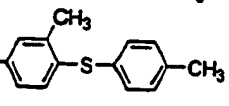
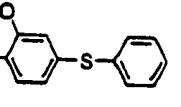
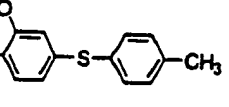
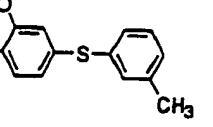


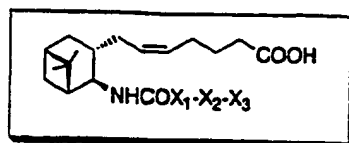
No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-204	
2a-205	
2a-206	
2a-207	
2a-208	
2a-209	
2a-210	
2a-211	
2a-212	
2a-213	



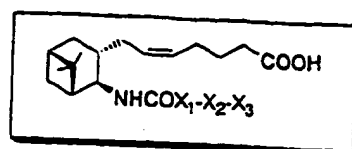
No.	$X_1-X_2-X_3$
2a-214	
2a-215	
2a-216	
2a-217	
2a-218	
2a-219	
2a-220	
2a-221	
2a-222	
2a-223	



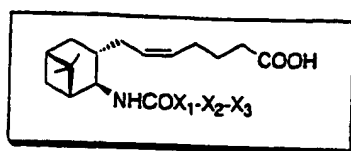
No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-224	
2a-225	
2a-226	
2a-227	
2a-228	
2a-229	
2a-230	
2a-231	
2a-232	
2a-233	



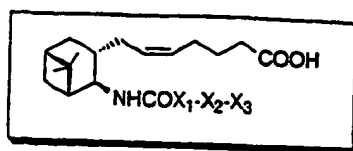
No.	$X_1-X_2-X_3$
2a-234	
2a-235	
2a-236	
2a-237	
2a-238	
2a-239	
2a-240	
2a-241	
2a-242	
2a-243	

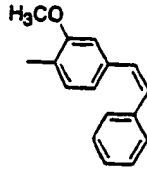
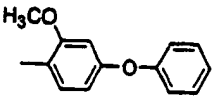
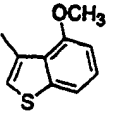
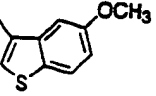
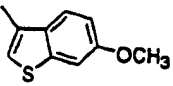
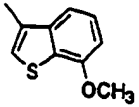
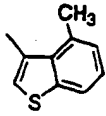
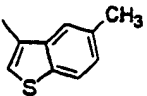
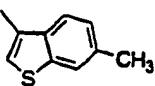
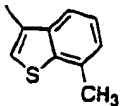


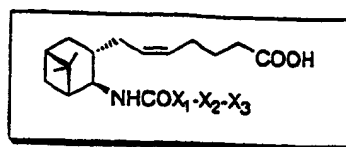
No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-244	
2a-245	
2a-246	
2a-247	
2a-248	
2a-249	
2a-250	
2a-251	

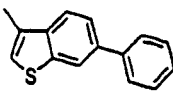

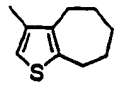
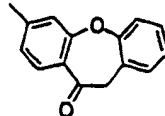
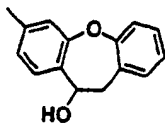
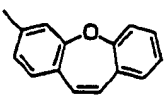
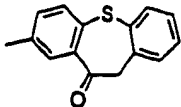
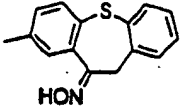
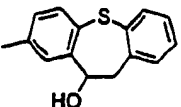
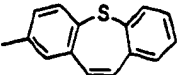


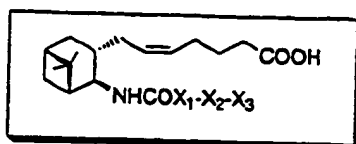
No.	$X_1-X_2-X_3$
2a-252	
2a-253	
2a-254	
2a-255	
2a-256	
2a-257	



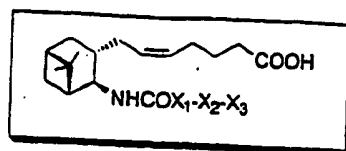
No.	X ₁ -X ₂ -X ₃
2a-258	
2a-259	
2a-260	
2a-261	
2a-262	
2a-263	
2a-264	
2a-265	
2a-266	
2a-267	



No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-268	
2a-269	
2a-270	
2a-271	
2a-272	
2a-273	
2a-274	
2a-275	
2a-276	
2a-277	



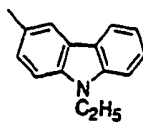
No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-278	
2a-279	
2a-280	
2a-281	
2a-282	
2a-283	
2a-284	
2a-285	
2a-286	
2a-287	



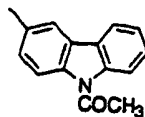
No.

 $\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$

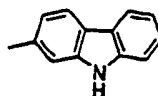
2a-288



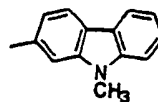
2a-289



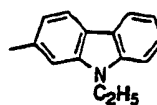
2a-290



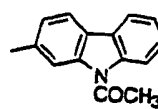
2a-291



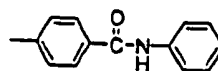
2a-292



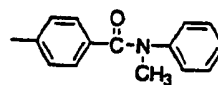
2a-293



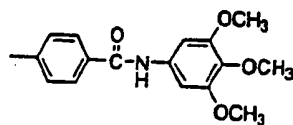
2a-294

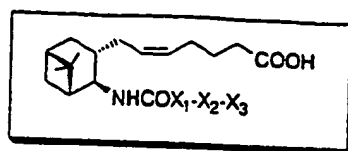


2a-295

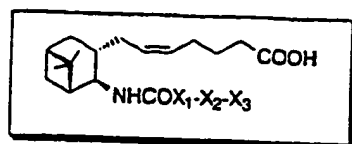


2a-296



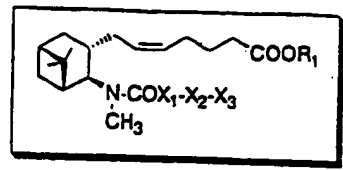


No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-297	
2a-298	
2a-299	
2a-300	
2a-301	
2a-302	
2a-303	
2a-304	
2a-305	
2a-306	



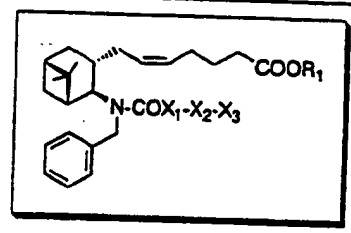
No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2a-307	
2a-308	
2a-309	
2a-310	
2a-311	
2a-312	
2a-313	
2a-314	
2a-315	

表 2b



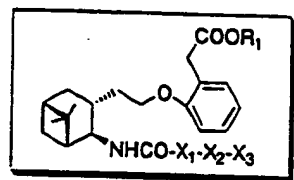
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2b-1	H	
2b-2	H	

表 2c



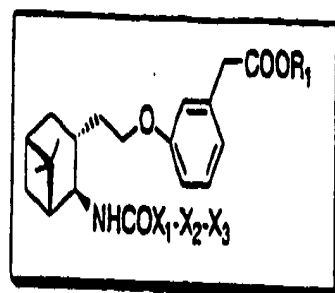
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2c-1	H	
2c-2	H	
2c-3	H	

表 2d



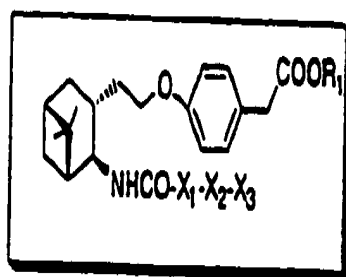
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2d-1	H	
2d-2	H	
2d-3	H	

表2e



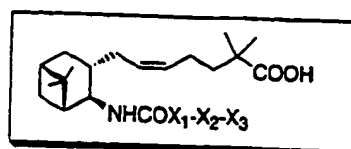
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2e-1	H	
2e-2	H	
2e-3	H	

表2f



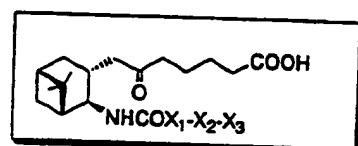
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
2f-1	H	
2f-2	H	
2f-3	H	

表 2h



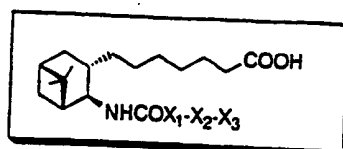
No.	X ₁ -X ₂ -X ₃
2h-1	
2h-2	
2h-3	
2h-4	
2h-5	
2h-6	

表 2i



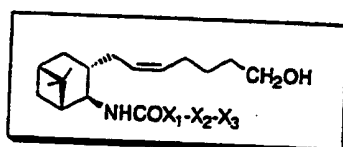
No.	X ₁ -X ₂ -X ₃
2i-1	
2i-2	
2i-3	
2i-4	
2i-5	
2i-6	

表 2j



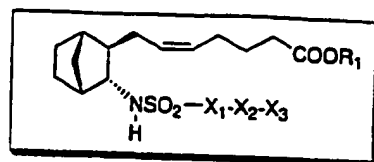
No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2j-1	
2j-2	
2j-3	
2j-4	
2j-5	
2j-6	

表 2k

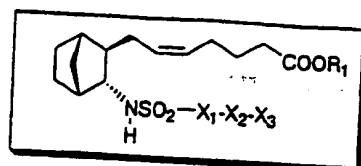


No.	$\text{X}_1\text{-X}_2\text{-X}_3$
2k-1	
2k-2	
2k-3	
2k-4	
2k-5	
2k-6	

表 3a

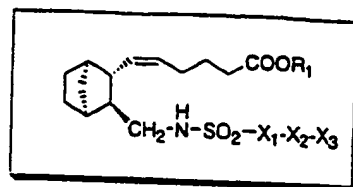


No.	R_1	$X_1\text{--}X_2\text{--}X_3$
3a-1	CH_3	
3a-2	H	
3a-3	CH_3	
3a-4	H	
3a-5	$\text{H}_3\text{N}^+\text{C}(\text{CH}_2\text{OH})_3$	
3a-6	Na	
3a-7	$1/2 \text{ Ca}$	
3a-8	H	
3a-9	H	
3a-10	CH_3	
3a-11	H	
3a-12	CH_3	
3a-13	H	
3a-14	CH_3	
3a-15	CH_3	
3a-16	H	
3a-17	CH_3	
3a-18	H	



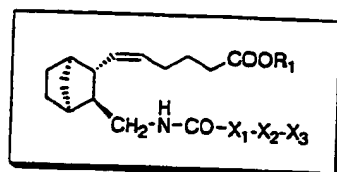
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
3a-19	CH ₃	
3a-20	H	
3a-21	CH ₃	
3a-22	H	
3a-23	CH ₃	
3a-24	H	
3a-25	H	-(CH ₂) ₃ CH ₃
3a-26	CH ₃	-(CH ₂) ₇ CH ₃
3a-27	H	-(CH ₂) ₇ CH ₃
3a-28	CH ₃	
3a-29	H	
3a-30	CH ₃	
3a-31	CH ₃	
3a-32	H	
3a-33	Na	
3a-34	H	
3a-35	Na	

表 3b



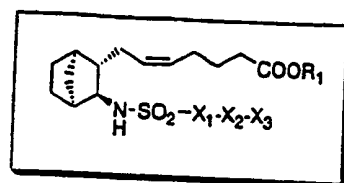
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
3b-1	CH ₃	
3b-2	H	
3b-3	H	
3b-4	H	

表 3c

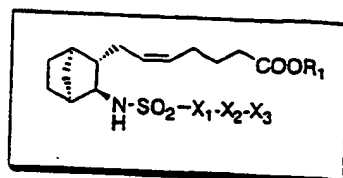


No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
3c-1	H	

表 3d



No.	R_1	$\text{X}_1-\text{X}_2-\text{X}_3$
3d-1	1/2 Ca	
3d-2	Na	
3d-3	Na	
3d-4	Na	
3d-5	CH_3	
3d-6	H	
3d-7	CH_3	
3d-8	H	
3d-9	Na	
3d-10	CH_3	
3d-11	H	
3d-12	Na	
3d-13	1/2 Ca	
3d-14	H	
3d-15	Na	



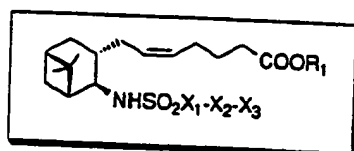
No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
3d-16	H	
3d-17	H	
3d-18	H	$-(CH_2)_3CH_3$
3d-19	CH ₃	$-NHCH_3$
3d-20	H	
3d-21	CH ₃	
3d-22	H	
3d-23	H	
3d-24	H	
3d-25	H	
3d-26	Na	
3d-27	H	
3d-28	Na	
3d-29	H	
3d-30	Na	

ラセミ体

ラセミ体

ラセミ体

表 3c



No.	R ₁	X ₁ -X ₂ -X ₃
3e-1	1/2Ca	

上記化合物の物性値を以下に示す。尚、上記化合物No.は、表中の化合物のNo.と対応する。

No.1 a - 4

$[\alpha]_D = -11.5^\circ$ (CHCl₃, c=1.01, 23.5°C).

No.1 a - 5

$[\alpha]_D = -10.0^\circ$ (CHCl₃, c=1.01, 25.0°C).

No.1 a - 6

CDCl₃ 300MHz

0.93-1.96(14H, m), 2.20-2.26(3H, m), 3.03(1H, m), 3.67(3H, s), 4.99(1H, d, J=6.6Hz), 5.10-5.24(2H, m), 7.37-7.51(3H, m), 7.54-7.64(3H, m), 7.76-7.88(2H, m), 8.11(1H, m).

IR(CHCl₃): 3384, 3278, 3026, 2952, 2874, 1727, 1436, 1411, 1324, 1155, 1097 /cm.

$[\alpha]_D = -9.0^\circ$ (CHCl₃, c=1.04, 22.0°C).

No.1 a - 7

CDCl₃ 300MHz

0.93-2.00(14H, m), 2.18(1H, m), 2.28(2H, t, J=7.2Hz), 3.04(1H, m), 5.15-5.25(2H, m), 5.28(1H, d, J=6.9Hz), 7.36-7.50(3H, m), 7.54-7.63(3H, m), 7.76-7.89(2H, m), 8.12(1H, m).

IR(CHCl₃): 3268, 3028, 2952, 2872, 1708, 1452, 1410, 1324, 1155, 1097 /cm.

$[\alpha]_D = -9.1^\circ$ (CHCl₃, c=1.01, 24.0°C).

No.1 a - 8

CDCl₃ 300MHz

0.94-1.99(14H, m), 2.21-2.29(3H, m), 3.05(1H, m), 3.67(3H, s), 4.92(1H, d, J=6.3Hz), 5.14-5.30(2H, m), 7.70-7.78(6H, m), 7.96-8.01(2H, m).

IR(CHCl₃):3376,3272,3018,2946,2868,1727,1616,1435,1388,1324,1162,1130,1069 /cm.

[α]D= +1.6° (CHCl₃,c=1.01,24.0°C). mp.117-119°C.

No.1 a - 9

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.08(14H,m),2.19(1H,m), 2.32(2H,t,J=7.2Hz),3.06(1H,m),5.20-5.30(2H,m),5.34(1H,d,J=6.6Hz),7.69-7.78(6H,m),7.96-8.03(2H,m).

IR(CHCl₃):3260,3020,2950,2868,1708,1389,1324,1162,1130,1069 /cm.

[α]D= +13.3° (CHCl₃,c=1.05,24.0°C).

mp.118-120°C

No.1 a - 1 0

CDCl₃ 300MHz

0.96-1.98(14H,m),2.15-2.32(3H,m),3.04(1H,m),3.66(3H,s),5.12-5.26(5H,m),7.67-7.78(4H,m),7.93-8.07(4H,m).

IR(CHCl₃):3276,3018,2946,2868,1726,1595,1435,1341,1162,1095 /cm.

[α]D= -1.5° (CHCl₃,c=1.01,25.0°C).

mp.133-139°C.

No.1 a - 1 1

CD3OD 300MHz

1.05-1.98(14H,m),2.13-2.22(3H,m),2.97(1H,m),5.09-5.22(2H,m),7.85-7.92(4H,m),7.95-8.05(4H,m).

IR(KBr):3385,3261,3069,3003,2954,2872,1708,1596,1428,1413,1378,1343,1326,1236,1186,1160,1096 /cm.

mp.144-146°C.

No.1 a - 1 2

CDCl₃ 300MHz

0.96-1.96(14H,m), 2.22-2.27(3H,m), 3.03(1H,m), 3.66(3H,s), 3.87(3H,s), 4.86(1H,
d, J=6.9Hz), 5.18-5.24(2H,m), 6.99-7.02(2H,m), 7.55-7.66(2H,m), 7.66-7.69(2H,m),
7.89-7.92(2H,m).

IR(CHCl₃): 3374, 3270, 3016, 2948, 2870, 1726, 1608, 1518, 1487, 1458, 1437, 1248, 1157, 1037.

[α]_D=+4.2° (CHCl₃, c=1.01, 24°C).

mp. 85-87°C.

No.1 a - 1 3

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.99(14H,m), 2.18(1H,m), 2.30(2H,t, J=7.2Hz), 3.04(1H,m), 3.86(3H,s), 5.18(1H,d, J=5.7Hz), 5.23-5.26(2H,m), 6.99-7.02(2H,m), 7.55-7.58(2H,m), 7.66-7.68(2H,m), 7.89-7.92(2H,m).

IR(CHCl₃): 3380, 3260, 3020, 2948, 2868, 1708, 1608, 1519, 1487, 1458, 1306, 1293, 1248, 1156 /cm.

[α]_D=+18.3° (CHCl₃, c=1.00, 25.5°C).

No.1 a - 1 4

CDCl₃ 300MHz

0.98-2.00(14H,m), 2.22(1H,m), 2.30(2H,t, J=7.2Hz), 3.04(1H,m), 3.86(3H,s), 5.18(1H,d, J=5.7Hz), 5.23-5.26(2H,m), 6.99-7.02(2H,m), 7.55-7.58(2H,m), 7.66-7.68(2H,m), 7.89-7.92(2H,m).

0.95-2.00(14H,m),2.17(1H,m),2.32(2H,t,J=7.2Hz),3.03(1H,m),5.20(1H,d,J=6.9 Hz),5.24-5.28(2H,m),7.13(1H,dd,J=4.8,3.3Hz),7.38(1H,d,J=4.8Hz),7.43(1H,d,J=3.3Hz),7.73(2H,d,J=8.4Hz),7.87(2H,d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3260,3022,2948,2868,1709,1593,1404,1321,1154/cm.

[α]D= +20.8° (CHCl₃,c=1.07,23°C).

mp.71-73°C.

No.1 a - 1 6

CDCl₃ 300MHz

0.98-2.00(14H,m),2.27(2H,t,J=7.5Hz),2.28(1H,m),3.13(1H,m),3.66(3H,s),4.90(1H,d,J=6.9Hz),5.25-5.29(2H,m),7.40-7.65(6H,m),7.76(1H,d,J=8.4Hz),7.90-8.02(4H,m).

IR(CHCl₃):3376,3276,3018,2946,2868,1726,1593,1435,1394,1322,1159/cm.

[α]D= +7.0° (CHCl₃,c=1.07,24°C).

No.1 a - 1 7

CDCl₃ 300MHz

1.02-2.07(14H,m),2.25(1H,m),2.34(2H,t,J=6.6Hz),3.14(1H,m),5.28-5.33(3H,m),7.39-7.57(4H,m),7.62-7.65(2H,m),7.76(1H,d,J=8.1Hz),7.89-8.02(4H,m).

IR(CHCl₃):3260,2948,2868,1709,1593,1394,1324,1157/cm.

[α]D=+20.2° (CHCl₃,c=1.02,24°C).

No.1 a - 1 8

CDCl₃ 300MHz

1.05-1.97(14H,m),2.25(2H,t,J=7.2Hz),2.33(1H,m),3.12(1H,m),3.67(3H,s),4.91(1H,d,J=6.6Hz),5.24-5.29(2H,m),7.24(1H,d,J=3.9Hz),7.39-7.45(3H,m),7.56(1H,d,J=3.9Hz),7.59-7.62(2H,m).

IR(CHCl₃):3372,3272,,3018,2946,2868,1727,1433,1331,1152/cm.

[α]D=-5.7° (CHCl₃,c=1.01,23°C).

No.1 a - 1 9

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.05(14H,m),2.28-2.33(3H,m),3.13(1H,m),5.18(1H,d,J=6.3Hz),5.27-5.31(2H,m),7.24(1H,d,J=4.2Hz),7.39-7.42(3H,m),7.56(1H,d,J=4.2Hz),7.58-7.62(2H,m).

IR(CHCl₃):3372,3254,3018,2948,2868,1707,1431,1328,1151/cm.

[α]D= +4.5° (CHCl₃,c=1.01,21.5°C).

No.1 a - 2 0

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.00(14H,m),2.26(2H,t,J=7.5Hz),2.33(1H,m),3.11(1H,m),3.68(3H,s),4.92(1H,d,J=6.0Hz),5.27(2H,m),7.05(1H,m),7.10(1H,d,J=3.6Hz),7.25(1H,m),7.32(1H,m),7.49(1H,d,J=3.6Hz).

IR(CHCl₃):3372,3272,3018,2946,2686,1727,1438,1417,1333,1151/cm.

[α]D=-9.2° (CHCl₃,c=1.01,25°C).

No.1 a - 2 1

CDCl₃ 300MHz

1.02-2.01(14H,m),2.28-2.34(3H,m),3.13(1H,m),5.12(1H,d,J=6.9Hz),5.28-5.32(2H,m),7.06(1H,m),7.10(1H,d,J=3.9Hz),7.25(1H,m),7.32(1H,m),7.50(1H,d,J=3.9Hz).

IR(CHCl₃):3350,3250,2948,1709,1440,1420,1330,1151.

[α]D=+2.5° (CHCl₃,c=1.00,25°C).

No.1 a - 2 2

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.05(14H,m),2.25(1H,m),2.35(2H,t,J=7.0Hz),3.11(1H,m),5.20-5.34(2H,m),5.41(1H,d,J=6.6Hz),7.31-7.49(5H,m),7.62(1H,d,J=7.8Hz),8.11(1H,d,d,J=1.8 and

d7.8Hz), 8.35(1H, d, J=1.8Hz).

IR(CHCl₃): 3384, 3271, 3025, 2958, 1708, 1608, 1559, 1537, 1357, 1168/cm.

[α]D=+18.3(CHCl₃, C=0.31, 22°C).

No.1 a - 2 3

CDCl₃ 300MHz

0.97-2.07(14H, m), 2.24(1H, m), 2.35(2H, t, J=6.9Hz), 3.09(1H, m), 3.86(3H, s), 5.24-5.35(2H, m), 5.44(1H, d, J=6.3Hz), 6.97-7.00(2H, m), 7.26-7.28(2H, m), 7.59(1H, d, J=8.1Hz), 8.06(1H, d, d, J=2.1 and 8.1Hz), 8.29(1H, d, J=2.1Hz).

IR(CHCl₃): 3384, 3270, 2959, 1709, 1609, 1535, 1519, 1357, 1302, 1255, 1226, 1169/cm.

[α]D=+17.0° (CHCl₃, C=1.00, 21°C).

No.1No.1 a - 2 4

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.00(14H, m), 2.20-2.25(1H, m), 2.26(2H, t, J=7.2Hz), 3.02-3.10(1H, m), 3.66(3H, s), 4.92(1H, d, J=6.6Hz), 5.16-5.31(2H, m), 7.52-7.60(3H, m), 7.94-8.06(6H, m).

IR(CHCl₃): 3376, 3020, 2946, 2868, 1726, 1436, 1366, 1298, 1164, 1090, 890/cm.

[α]D=+11.2±0.5° (CHCl₃, c=1.04, 23.5°C)

mp. 101-103°C

No.1 a - 2 5

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.08(14H, m), 2.15-2.22(1H, m), 2.33(2H, t, J=6.9Hz), 3.02-3.10(1H, m), 5.21-5.31(2H, m), 5.34(1H, d, J=6.3Hz), 7.51-7.59(3H, m), 7.92-8.07(6H, m).

IR(CHCl₃): 3258, 3022, 2948, 2868, 1707, 1399, 1328, 1298, 1163, 1089, 1051, 892/cm

[α]D=+29.8±0.7° (CHCl₃, c=1.05, 25°C)

mp.158-160°C

No.1 a - 2 6

Anal. Calcd for $C_{26}H_{30}N_3O_4SNa \cdot 0.8H_2O$: C, 60.29; H, 6.15; N, 8.11; S, 6.19; Na, 4.44.

Found: C, 60.15; H, 6.19; N, 8.15; S, 6.03; Na, 4.98.

$[\alpha]_D = -16.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.04, 25.0°C).

No.1 a - 2 7

CDCl₃ 300MHz

0.92-1.98(14H, m), 2.20(1H, m), 2.26(2H, t, J=7.5Hz), 3.03(1H, m), 3.12(6H, s), 3.66(3H, s), 4.87(1H, d, J=6.6Hz), 5.16-5.32(2H, m), 6.73-6.80(2H, m), 7.88-8.00(6H, m).

IR(CHCl₃): 3376, 3020, 2946, 1726, 1601, 1518, 1442, 1419, 1362, 1312, 1163, 1133, 1088 /cm.

$[\alpha]_D = +55.3^\circ$ (CHCl₃, c=0.53, 24.0°C).

mp.158-168°C

No.1 a - 2 8

CDCl₃+CD₃OD 300MHz

0.99-2.14(14H, m), 2.21(1H, m), 2.31(2H, t, J=7.2Hz), 2.94(1H, m), 3.12(6H, s), 5.22-5.38(2H, m), 6.73-6.81(2H, m), 7.87-8.00(6H, m).

IR(KBr): 3434, 3309, 2946, 1708, 1604, 1520, 1442, 1416, 1366, 1312, 1252, 1164, 1155, 1134, 1091 /cm.

$[\alpha]_D =$ 測定不能 (着色 , エネルギー不足)

mp.193-196°C

No.1 a - 2 9

CD₃OD 300MHz

1.02-1.96(14H, m), 2.10(2H, t, J=7.8Hz), 2.16(1H, m), 2.98(1H, m), 3.11(6H, s), 5.07-

5.27(2H,m),6.80-6.87(2H,m),7.84-8.00(6H,m).

IR(KBr):3433,3087,3004,2949,2871,1604,1565,1520,1444,1420,1364,1312,1253,11638,1136,1090 /cm.

$[\alpha]_D$ = 測定不能

No.1 a - 3 0

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.99(14H,m),2.22(1H,m),2.26(2H,t,J=7.2Hz),2.35(3H,s),3.06(1H,m),3.66(3H,s),4.95(1H,d,J=6.9Hz),5.15-5.30(2H,m),7.26-7.32(2H,m),7.97-8.06(6H,m).

IR(CHCl₃):3374,2996,2946,2868,1763,1728,1591,1495,1435,1368,1299,1228,1192,1163,1139 /cm.

$[\alpha]_D$ = +12.9° (CHCl₃, c=1.04, 26.0°C).

No.1 a - 3 1

CDCl₃ 300MHz

0.93-2.01(14H,m),2.19(1H,m),2.31(2H,t,J=7.2Hz),2.35(3H,s),3.06(1H,m),5.17-5.32(2H,m),7.25-7.32(2H,m),7.96-8.07(6H,m).

IR(CHCl₃):3267,3028,2952,2874,1759,1708,1592,1495,1368,1328,1299,1163,1138,1088,1050,1008/cm.

$[\alpha]_D$ = +21.7° (CHCl₃, C=0.51, 22°C).

No.1 a - 3 2

CDCl₃ 300MHz

0.93-1.99(14H,m),2.21(1H,m),2.27(2H,t,J=7.2Hz),3.05(1H,m),3.67(3H,s),4.92(1H,d,J=6.6Hz),5.15-5.30(2H,m),6.72(1H,s),6.96-7.00(2H,m),7.86-8.04(6H,m).

IR(CHCl₃):3374,3276,3018,2946,2686,1725,1605,1589,1502,1433,1396,1330,1271,1164,1135,1089 /cm. $[\alpha]_D$ = +18.6° (CHCl₃, c=1.00, 26.0°C).

No.1 a - 3 3

CDCl₃+CD₃OD 300MHz

0.98-2.08(14H,m), 2.20(1H,m), 2.28(2H,t, J=7.2Hz), 2.98(1H,m), 5.18-5.32(2H,m),
6.92-6.99(2H,m), 7.85-8.02(6H,m).

IR(KBr): 3385, 3248, 2948, 2876, 1717, 1601, 1505, 1430, 1399, 1296, 1280, 1219, 1116
5, 1136, 1092 /cm.

[α]_D = -16.0° (CH₃OH, c=1.08, 26.0°C).

mp. 208-210°C

No.1 a - 3 4

mp. 82-83°C [α]_D = +10.6° (CHCl₃, c=1.01, 23.5°C).

No.1 a - 3 5

mp. 80-82°C [α]_D = -1.8° (CHCl₃, c=1.07, 22.0°C).

No.1 a - 3 6

TLC R_f=0.25 (酢酸エチル-n-ヘキサン=1:1 (0.3%酢酸))

No.1 a - 3 7

CDCl₃ 300MHz

0.92-1.96(14H,m), 2.21(1H,m), 2.27(2H,t, J=7.4Hz), 3.01(1H,m), 3.66(3H,s), 4.71(1H,d, J=6.6Hz), 5.14-5.29(2H,m), 7.12(1H,d, J=16.2Hz), 7.24(1H,d, J=16.2Hz), 7.28-7.42(3H,m), 7.52-7.56(2H,m), 7.62(2H,d, J=8.7Hz), 7.85(2H,d, J=8.7Hz).

IR(CHCl₃): 3384, 3283, 3023, 2954, 2876, 1730, 1595, 1494, 1317, 1163, 1147 /cm.

[α]_D = +10.5° (CHCl₃, c=1.01, 24°C).

mp 116-117 °C.

No.1 a - 3 8

CDCl₃ 300MHz

0.92-1.96(14H,m), 2.21(1H,m), 2.27(2H,t, J=7.4Hz), 3.01(1H,m), 3.66(3H,s), 4.71(1H,d, J=6.6Hz), 5.14-5.29(2H,m), 7.12(1H,d, J=16.2Hz), 7.24(1H,d, J=16.2Hz), 7.28-7.42(3H,m), 7.52-7.56(2H,m), 7.62(2H,d, J=8.7Hz), 7.85(2H,d, J=8.7Hz).

7.11(1H,d,J=16.2Hz),7.23(1H,d,J=16.2Hz),7.28-7.41(3H,m),7.52-7.55(2H,m),7.61(2H,d,J=8.7Hz),7.86(2H,d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3515,3384,3270,3022,3015,2957,2876,2669,1708,1595,1496,1320,1157 /cm.

[α]_D= +27.1° (CHCl₃,c=1.02,24°C).

No.1 a - 3 9

CDCl₃ 300MHz

0.92-1.99(14H,m),2.15(1H,m),2.28(2H,t,J=7.4Hz),3.01(1H,m),3.68(3H,s),4.96(1H,d,J=6.6Hz),5.16-5.32(2H,m),6.60(1H,d,J=12.0Hz),6.74(1H,d,J=12.0Hz),7.16-7.23(5H,m),7.35(2H,d,J=8.4Hz),7.72(2H,d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3384,3283,3023,3015,2954,2876,1730,1595,1493,1324,1163,1147 /cm.

[α]_D= +13.7° (CHCl₃,c=1.00,24°C).

No.1 a - 4 0

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.16(14H,m),2.12(1H,m),2.34(2H,t,J=7.2Hz),3.02(1H,m),5.16(1H,d,J=6.9 Hz),5.23-5.34(2H,m),6.60(1H,d,J=12.3Hz),6.74(1H,d,J=12.3Hz),7.14-7.24(5H,m),7.35(2H,d,J=8.1Hz),7.72(2H,d,J=8.1Hz).

IR(CHCl₃):3515,3384,3269,3025,3021,3014,2957,2876,2668,1709,1595,1322,1162,1147 /cm.

[α]_D= +26.4° (CHCl₃,c=1.00,24°C).

No.1 a - 4 1

CDCl₃ 300MHz

0.98-1.99(14H,m),2.17(1H,m),2.32(2H,t,J=7.2Hz),3.00(1H,m),3.84(3H,s),5.20-5.26(3H,m),6.90-6.95(2H,m),6.98(1H,d,J=16.2Hz),7.17(1H,d,J=16.2Hz),7.46-7.49(2H,m),7.58(2H,d,J=8.4Hz),7.83(2H,d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3258,3018,3002,2950,1709,1590,1509,1457,1404,1302,1250,1153
/cm.

[α]D= +30.2° (CHCl₃,c=1.00,23°C).

mp.99-100 °C

No.1 a - 4 2

CDCl₃ 300MHz

1.01-1.99(14H,m),2.28(2H,t,J=7.2Hz),2.30(1H,m),3.10(1H,m),3.66(3H,s),5.07(1H,br),5.25-5.30(2H,m),6.98-7.04(2H,m),7.16(1H,d,J=16.2Hz),7.28-7.37(3H,m),7.47-7.50(3H,m).

IR(CHCl₃):3372,3276,3020,2946,2870,1727,1491,1433,1331,1152 /cm.

[α]D= -11.5° (CHCl₃,c=1.07,21.5°C).

No.1 a - 4 3

CDCl₃ 300MHz

0.98-2.00(14H,m),2.11-2.36(3H,m),3.12(1H,m),5.10(1H,d,J=6.6Hz),5.29-5.32(2H,m),6.99-7.04(2H,m),7.23(1H,d,J=21.6Hz),7.32-7.49(6H,m).

IR(CHCl₃):3380,3248,3020,2948,2868,1709,1491,1430,1329,1151/cm.

[α]D= +3.4° (CHCl₃,c=1.03,25°C).

No.1 a - 4 4

CDCl₃ 300MHz

1.00-2.00(14H,m),2.13(1H,m),2.29(2H,t,J=7.4Hz),2.90-3.13(5H,m),3.68(3H,s),4.74(1H,d,J=6.6Hz),5.15-5.30(2H,m),7.18-7.29(7H,m),7.76(2H,d,J=8.1Hz).

IR(CHCl₃):3384,3282,3063,3028,3023,3016,2953,2876,1730,1599,1496,1319,1157 /cm.

[α]D=+2.3° (CHCl₃,c=1.00,25°C).

No.1 a - 4 5

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.05(14H,m), 2.09(1H,m), 2.35(2H,t, J=6.9Hz), 2.90-3.13(5H,m), 5.18(1H,d, J=6.6Hz), 5.24-5.34(2H,m), 7.10-7.27(7H,m), 7.76(2H,d, J=8.4Hz).

IR(CHCl₃): 3510, 3384, 3270, 3087, 3063, 3026, 3018, 3014, 2955, 2876, 2670, 1708, 1599, 1496, 1318, 1157/cm.

[α]_D=+8.5° (CHCl₃, c=1.01, 25°C).

No.1 a - 4 6

[α]_D=+6.8° (CHCl₃, c=1.05, 25°C). mp. 99-100°C.

No.1 a - 4 7

CDCl₃ 300MHz

0.97-2.01(14H,m), 2.14(1H,m), 2.36(2H,t, J=7.2Hz), 3.02(1H,m), 5.23(1H,d, J=5.4 Hz), 5.26-5.30(2H,m), 7.37-7.39(3H,m), 7.54-7.58(2H,m), 7.63-7.66(2H,m), 7.85-7.88(2H,m).

IR(CHCl₃): 3375, 3260, 3022, 2948, 2212, 1707, 1596, 1497, 1396, 1322, 1160/cm.

[α]_D=+25.0° (CHCl₃, c=1.02, 24°C). mp. 117-118°C.

No.1 a - 4 8

CD₃OD 300MHz

1.05-1.93(14H,m), 2.10-2.15(3H,m), 2.96(1H,m), 5.08-5.28(2H,m), 7.38-7.40(3H,m), 7.554-7.56(2H,m), 7.69(1H,d, J=8.4Hz), 7.87(1H,d, J=8.4Hz).

No.1 a - 4 9

CDCl₃ 300MHz

0.96-1.97(14H,m), 2.24(1H,m), 2.31(2H,t, J=6.9Hz), 3.05(1H,m), 3.69(3H,s), 5.15(1H,d, J=6.6Hz), 5.25-5.27(2H,m), 7.40-7.43(3H,m), 7.61-7.64(2H,m), 7.85(1H,d, J=8.1Hz), 8.07(1H,dd, J=8.1, 1.8Hz), 8.58(1H,d, J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3374,3020,2948,2870,2212,1726,1606,1530,1493,1437,1345,1167/
cm.

$[\alpha]_D^{25} = +2.4^\circ$ (CHCl₃, c=1.03, 25°C). mp. 77-79°C.

No.1 a - 5 0

CDCl₃ 300MHz

1.00-2.02(14H,m), 2.20(1H,m), 2.34(2H,t, J=6.6Hz), 3.08(1H,m), 5.26-5.29(2H,m),
5.41(1H,d, J=6.9Hz), 7.40-7.43(3H,m), 7.61-7.64(2H,m), 7.84(1H,d, J=8.1Hz), 8.07
(1H,dd, J=8.4, 1.8Hz), 8.57(1H,dd, J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3380,3254,2952,2880,2212,1707,1606,1531,1493,1409,1344,1166.

$[\alpha]_D^{25} = +23.4^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 25°C).

No.1 a - 5 1

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.98(14H,m), 2.23(1H,m), 2.30(2H,t, J=7.2Hz), 3.00(1H,m), 3.66(3H,s), 4.56(
2H,br), 4.70(1H,d, J=6.9Hz), 5.20-5.29(2H,m), 7.15(1H,dd, J=7.8, 1.8Hz), 7.23(1H,
d, J=1.8Hz), 7.36-7.39(3H,m), 7.46(1H,d, J=7.8Hz), 7.53-7.56(2H,m).

IR(CHCl₃):3494,3386,3028,2952,2874,1725,1611,1559,1497,1422,1317,1162/
cm.

No.1 a - 5 2

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.04(16H,m), 2.20(1H,m), 2.36(2H,t, J=6.9Hz), 2.99(1H,m), 5.17(1H,d, J=6.3
Hz), 5.28-5.31(2H,m), 7.18(1H,dd, J=9.6, 1.8Hz), 7.25(1H,m), 7.36-7.39(3H,m), 7.4
6(1H,d, J=7.8Hz), 7.52-7.56(2H,m).

IR(CHCl₃):3482,3378,3260,3022,2948,2868,1708,161

2,1495,1422,1317/cm.

$[\alpha]_D^{25} = +15.0^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 24°C).

No.1 a - 5 3

CDCl₃ 300MHz

1.01-2.05(15H,m), 2.31(2H,t,J=7.2Hz), 3.10(1H,m), 3.67(3H,s), 5.02(1H,br), 5.26-5.33(2H,m), 7.18(1H,d,J=4.2Hz), 7.36-7.39(3H,m), 7.48(1H,d,J=4.2Hz), 7.51-7.55(2H,m).

IR(CHCl₃): 3372, 3270, 3018, 3004, 2946, 2868, 2202, 1726, 1486, 1433, 1336, 1154/cm.

$[\alpha]_D^{+0.6^\circ}$ (CHCl₃, c=1.11, 25°C), $[\alpha]_{436}^{+17.8^\circ}$ (CHCl₃, c=1.11, 25°C).

No.1 a - 5 4

CDCl₃ 300MHz

0.99-2.11(14H,m), 2.27(1H,m), 2.37(2H,t,J=7.5Hz), 3.13(1H,m), 5.16(1H,d,J=6.6Hz), 5.31-5.35(2H,m), 7.18(1H,d,J=3.6Hz), 7.37-7.39(3H,m), 7.50(1H,d,J=3.6Hz), 7.52-7.55(2H,m).

IR(CHCl₃): 3484, 3370, 3246, 2948, 2868, 2202, 1708, 1486, 1429, 1335, 1153/cm.

$[\alpha]_D^{+17.8^\circ}$ (CHCl₃, c=1.00, 24°C). mp. 95-96°C

No.1 a - 5 5

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.92(14H,m), 2.15(1H,m), 2.24(2H,t,J=7.5Hz), 3.00(1H,m), 3.66(3H,s), 5.10-5.30(3H,m), 7.40-7.60(7H,m), 7.70(1H,d,J=7.8Hz), 8.08(1H,d,J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3356, 3020, 2948, 2868, 2210, 1727, 1490, 1458, 1437, 1341, 1165/cm.

$[\alpha]_D^{-58.4^\circ}$ (CHCl₃, c=1.00, 26°C). mp. 84-85°C.

No.1 a - 5 6

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.95(14H,m), 2.10(1H,m), 2.27(2H,t,J=6.9Hz), 3.00(1H,m), 5.17-5.21(2H,m), 5.38(1H,d,J=6.9Hz), 7.39-7.60(7H,m), 7.70(1H,dd,J=7.8, 1.5Hz), 8.07(1H,J=6.6, 1.5Hz).

IR(CHCl₃):3364,3026,2952,2874,2212,1707,1597,1491,1458,1411,1341,1164/
cm.

$[\alpha]_D = -43.1^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 25°C).

No.1 a - 5 7

CDCl₃ 300MHz

0.99-1.97(14H,m), 2.23-2.30(3H,m), 3.01(1H,m), 3.67(3H,s), 5.17-5.26(3H,m), 7.3
6-7.38(3H,m), 7.50-7.56(3H,m), 7.60(1H,m), 7.83(1H,m), 8.05(1H,m).

IR(CHCl₃):3376,3020,2946,2870,1727,1598,1491,1437,1412,1330,1245,1163/
cm.

$[\alpha]_D = -12.7^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 24°C).

No.1 a - 5 8

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.98(14H,m), 2.20(1H,m), 2.33(2H,t, J=6.9Hz), 3.02(1H,m), 5.19-5.28(3H,m),
7.36-7.38(3H,m), 7.47-7.55(3H,m), 7.69(1H,m), 7.83(1H,m), 8.04(1H,m).

IR(CHCl₃):3376,3260,3022,3002,2948,2868,2220,1708,1598,1490,1455,1412,1
327,1162/cm.

$[\alpha]_D = -8.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.01, 24°C).

No.1 a - 5 9

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.99(24H,m), 2.20(1H,m), 2.28(2H,t, J=7.8Hz), 2.53(1H,s), 2.96(1H,m), 3.69(
3H,s), 4.99(1H,d, J=6.6Hz), 5.18-5.20(2H,m), 7.53(2H,d, J=8.4Hz), 7.82(2H,d, J=8.
4Hz).

IR(CHCl₃):3583,3376,3002,2936,2852,1725,1591,1490,1437,1393,1325,1160/
cm.

$[\alpha]_D = -8.8^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 24°C).

No.1 a - 6 0

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.05(24H,m), 2.22(1H,m), 2.33(2H,m), 2.88(1H,m), 5.22-5.26(2H,m), 5.30(1H,
d, J=5.7Hz), 7.50(2H,d, J=8.7Hz), 7.80(2H,d, J=8.7Hz).

IR(CHCl₃): 3376, 3260, 3022, 2936, 2852, 1710, 1592, 1491, 1452, 1395, 1325, 1159/
cm.

[α]_D = -8.9° (CHCl₃, c=1.06, 24°C),

mp. 88-91°C

No.1 a - 6 1

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.24(23H,m), 2.29(2H,m), 2.99(1H,m), 3.69(3H,s), 4.76(1H,d, J=6.3Hz), 5.21-
5.24(2H,m), 6.28(1H,m), 7.50-7.53(2H,m), 7.77-7.80(2H,m).

IR(CHCl₃): 3374, 3270, 3018, 2942, 2868, 2196, 1726, 1589, 1490, 1435, 1324, 1158/
cm.

[α]_D = +7.7° (CHCl₃, c=1.02, 24°C), mp. 93-95°C

No.1 a - 6 2

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.45(23H,m), 2.36(2H,d, J=6.9Hz), 2.99(1H,m), 5.24(1H,d, J=6.3Hz), 5.24-5.3
2(2H,m), 6.28(1H,m), 7.50-7.53(2H,m), 7.78-7.81(2H,m). IR(CHCl₃): 3468, 3374,
3260, 3020, 2942, 2868, 2196, 1598, 1490, 1455, 1398, 1322, 1157/cm.

[α]_D = +19.4° (CHCl₃, c=1.03, 24°C).

No.1 a - 6 3

CDCl₃ 300MHz

0.93-1.95(25H,m), 2.16(1H,m), 2.29(2H,t, J=7.2Hz), 2.43(2H,t, J=6.9Hz), 2.94(1H,
m), 3.69(3H,s), 4.95(1H,d, J=6.9Hz), 5.21-5.24(2H,m), 7.49(2H,d, J=8.7Hz), 7.79(2
H, J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3376,3018,2946,2866,2222,1727,1592,1456,1435,1325,1158/cm.
 [α]_D=+3.7° (CHCl₃,c=1.00,25°C).

No.1 a - 6 4

CDCl₃ 300MHz

0.93-1.97(26H,m),2.35(2H,t,J=7.2Hz),2.43(2H,t,J=7.2Hz),3.00(1H,m),5.08(1H,
 d,J=6.6Hz),5.26-5.27(2H,m),7.49(2H,d,J=8.7Hz),7.78(2H,d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3260,3020,2948,2864,2222,1708,1592,1489,1456,1397,1324,1156/c
 m.

[α]_D=+14.4° (CHCl₃,c=1.00,25°C) mp.70-71°C.

No.1 a - 6 5

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.98(14H,m),2.18(1H,m),2.30(2H,t,J=7.2Hz),3.00(1H,m),3.67(3H,s),4.83(
 1H,d,J=6.9Hz),5.22-5.25(2H,m),5.54(1H,br),6.82-6.85(2H,m),7.42-7.45(2H,m),
 7.59-7.62(2H,m),7.82-7.85(2H,m).

IR(CHCl₃):3576,3374,3018,2946,2868,2208,1725,1607,1587,1514,1435,1325,1
 270,1162,1133/cm.

[α]_D=+9.1° (CHCl₃,c=1.03,24°C), mp.111-112°C

No.1 a - 6 6

CDCl₃ 300MHz

0.97-2.03(14H,m),2.15(1H,m),2.35(2H,t,J=7.5Hz),3.00(1H,m),5.17(1H,d,J=6.6
 Hz),5.26-5.30(2H,m),6.82-6.85(2H,m),7.42-7.45(2H,m),7.59-7.62(2H,m),7.82-7.
 85(2H,m).

IR(CHCl₃):3260,2948,2870,2208,1709,1607,1587,1514,1396,1325,1270,1162,1
 133/cm.

[α]_D=-21.0° (CHCl₃,c=1.00,23°C), mp.161-162°C

No.1 a - 6 7

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.98(14H,m), 2.20(1H,m), 2.29(2H,t, J=7.2Hz), 3.01(1H,m), 3.67(3H,s), 4.82(1H,d, J=6.6Hz), 5.19-5.27(2H,m), 7.05-7.10(2H,m), 7.51-7.56(2H,m), 7.61-7.64(2H,m), 7.84-7.87(2H,m).

IR(CHCl₃): 3374, 3280, 3020, 2946, 2868, 2214, 1727, 1589, 1509, 1435, 1327, 1233, 1161, 1134/cm.

[α]_D=+6.7° (CHCl₃, c=1.01, 24°C), mp. 84-85°C

No.1 a - 6 8

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.01(14H,m), 2.15(1H,m), 2.34(2H,t, J=6.9Hz), 3.02(1H,m), 5.23-5.27(3H,m), 7.04-7.10(2H,m), 7.51-7.56(2H,m), 7.61-7.64(2H,m), 7.85-7.88(2H,m).

IR(CHCl₃): 3374, 3258, 3020, 2948, 2868, 2214, 1708, 1589, 1509, 1455, 1398, 1322, 1156/cm.

[α]_D=+22.6° (CHCl₃, c=1.02, 24°C), mp. 135-136°C

No.1 a - 6 9

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.98(14H,m), 2.19(1H,m), 2.29(2H,t, J=7.2Hz), 2.39(3H,s), 3.01(1H,m), 3.69(3H,s), 4.80(1H,d, J=6.6Hz), 5.20-5.29(2H,m), 7.18(2H,d, J=8.1Hz), 7.44(2H,d, J=8.1Hz), 7.62(2H,d, J=8.4Hz), 7.84(2H,d, J=8.4Hz).

IR(CHCl₃): 3374, 3022, 2946, 2868, 2210, 1727, 1589, 1511, 1436, 1323, 1161, 1133/cm.

[α]_D=+9.2° (CHCl₃, c=1.02, 24°C).

mp. 116-118°C

No.1 a - 7 0

CDCl₃ 300MHz

1.15-2.00(14H,m), 2.13(1H,m), 2.33-2.38(5H,m), 3.04(1H,m), 5.14(1H,d, J=6.6Hz),
5.25-5.30(2H,m), 7.17(2H,d, J=7.8Hz), 7.44(2H,d, J=7.8Hz), 7.62(2H,d, J=8.4Hz),
7.85(2H,d, J=8.4Hz).

IR(CHCl₃): 3380, 3260, 3020, 2948, 2868, 2210, 1708, 1590, 1511, 1396, 1324, 1160, 1133/cm. $[\alpha]_D^{25} = +24.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 24°C).

No.1 a - 7 1

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.96(14H,m), 2.19(1H,m), 2.29(2H,t, J=7.2Hz), 3.00(1H,m), 3.20(1H,s), 3.65(3H,s), 4.81(1H,d, J=6.6Hz), 5.20-5.27(2H,m), 7.46-7.54(4H,m), 7.62-7.65(2H,m), 7.85-7.88(2H,m).

IR(CHCl₃): 3374, 3290, 3018, 3002, 2946, 2868, 2212, 2110, 1726, 1591, 1507, 1435, 1401, 1324, 1161/cm.

$[\alpha]_D^{25} = +9.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.01, 24°C), mp. 136-138°C,

No.1 a - 7 2

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.01(14H,m), 2.14(1H,m), 2.35(2H,t, J=7.2Hz), 3.05(1H,m), 3.20(1H,s), 5.16(1H,d, J=7.2Hz), 5.26-5.29(2H,m), 7.45-7.53(4H,m), 7.63(2H,d, J=8.4Hz), 7.87(2H,d, J=8.4Hz).

IR(CHCl₃): 3462, 3374, 3290, 3024, 2948, 2868, 2212, 2110, 1708, 1591, 1508, 1455, 1401, 1321, 1274, 1160, 1132/cm.

$[\alpha]_D^{25} = +24.3^\circ$ (CHCl₃, c=1.03, 24°C), mp. 96-99°C

No.1 a - 7 3

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.98(14H,m), 2.19(1H,m), 2.27-2.32(5H,m), 3.01(1H,m), 3.67(3H,s), 4.80(1H,d, J=6.6Hz), 5.20-5.27(2H,m), 7.12(2H,m), 7.56(2H,m), 7.63(2H,m), 7.84(2H,m).

IR(CHCl₃): 3374, 3276, 3018, 2946, 2868, 2214, 1762, 1730, 1589, 1506, 1435, 1368, 1133/cm.

161/cm.

$[\alpha]_D = +7.8^\circ$ (CHCl₃, c=1.02, 24°C), mp. 102-104°C

No.1 a - 7 4

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.05(14H,m), 2.15(1H,m), 2.32-2.37(5H,m), 3.02(1H,m), 5.14(1H,d, J=6.6Hz), 5.26-5.30(2H,m), 7.10-7.13(2H,m), 7.54-7.57(2H,m), 7.62-7.64(2H,m), 7.84-7.87(2H,m).

IR(CHCl₃): 3482, 3250, 3022, 2946, 2868, 2214, 1716, 1709, 1589, 1507, 1454, 1396, 1368, 1322, 1195, 1161/cm.

$[\alpha]_D = +15.0^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 24°C), mp. 129-131°C

No.1 a - 7 5

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.99(14H,m), 2.20(1H,m), 2.30(2H,t, J=7.2Hz), 3.02(1H,m), 3.67(3H,s), 3.94(3H,s), 4.79(1H,d, J=6.6Hz), 5.19-5.29(2H,m), 7.60-7.63(2H,m), 7.65-7.67(2H,m), 7.86-7.89(2H,m), 8.04-8.06(2H,m).

IR(CHCl₃): 3378, 3018, 2946, 2880, 1720, 1604, 1435, 1307, 1276, 1161, 1106 /cm.

$[\alpha]_D = +7.3^\circ$ (CHCl₃, c=1.01, 25°C), mp. 132-133°C

No.1 a - 7 6

CDCl₃+CD₃OD 300MHz

1.04-2.05(14H,m), 2.19(1H,m), 2.32(2H,t, J=6.9Hz), 2.93(1H,m), 5.27-5.31(2H,m), 7.60-7.63(2H,m), 7.65-7.68(2H,m), 7.86-7.89(2H,m), 8.05-8.07(2H,m).

IR(CHCl₃): 3402, 3299, 2955, 2876, 2665, 2549, 1455, 1422, 1313, 1281, 1164 /cm.

$[\alpha]_D = -21.1^\circ$ (CH₃OH, c=1.03, 23°C), mp. 227-229(dec.)

No.1 a - 7 7

CDCl₃ 300MHz

0.96-1.99(14H,m),2.20(1H,m),2.30(2H,t,J=7.2Hz),3.02(1H,m),3.68(3H,s),4.88(1H,d,J=6.3Hz),5.19-5.29(2H,m),7.67-7.72(4H,m),7.89-7.91(2H,m),8.24-8.27(2H,m).

IR(CHCl₃):3376,3276,3020,2946,2870,2214,1726,1594,1519,1455,1435,1389,1344,1161/cm.

[α]_D=+7.7° (CHCl₃,c=1.02), mp.87-89°C

No.1 a - 7 8

CDCl₃ 300MHz

0.98-2.00(14H,m),2.18(1H,m),2.34(2H,t,J=7.2Hz),3.02(1H,m),5.24-5.28(2H,m),5.32(1H,d,J=5.7Hz),7.67-7.72(4H,m),7.89-7.92(2H,m),8.23-8.26(2H,m).

IR(CHCl₃):3374,3260,2948,2214,1708,1595,1344,1160/cm.

[α]_D=+23.3° (CHCl₃,c=1.00),

mp.102-103°C

No.1 a - 7 9

CDCl₃ 300MHz

0.93-2.02(14H,m),2.13(1H,m),2.36(2H,t,J=7.1Hz),3.05(1H,m),3.84(3H,s),5.18(1H,br),5.27-5.31(2H,m),6.88-6.91(2H,m),7.48-7.50(2H,m),7.60-7.63(2H,m),7.83-7.85(2H,m).

IR(CHCl₃):3380,3252,3020,2950,2868,2208,1708,1589,1511,1457,1396,1321,1286,1160/cm.

[α]_D=+26.7° (CHCl₃,C=1.00). mp.75-77°C

No.1 a - 8 0

CDCl₃ 300MHz

0.96-1.99(14H,m),2.21(1H,m),2.30(2H,t,J=7.8Hz),3.02(1H,m),3.68(3H,s),4.80(1H,d,J=6.6Hz),5.19-5.28(2H,m),7.51-7.77(5H,m),7.87-7.90(2H,m),8.13(1H,m).

IR(CHCl₃):3374,3270,3018,2946,2868,2216,1726,1607,1567,1527,1495,1456,1

436,1344,1296,1161/cm.

$[\alpha]_D^{+7.4}$ (CHCl₃, c=1.00, 22°C), mp. 68-70°C

No.1 a - 8 1

CDCl₃ 300MHz

0.97-2.01(14H,m), 2.16(1H,m), 2.34(2H,t, J=7.2Hz), 3.01(1H,m), 5.22-5.28(3H,m),
7.51(1H,m), 7.65(1H,m) 7.70-7.76(3H,m), 7.88-7.91(2H,m), 8.12(1H,dd, J=6.9Hz,
1.5Hz).

IR(CHCl₃): 3480, 3382, 3262, 3026, 2952, 2872, 2218, 1708, 1607, 1567, 1526, 1396, 1
343, 1225, 1160/cm.

$[\alpha]_D^{+22.0}$ (CHCl₃, c=1.00), mp. 92-94°C

No.1 a - 8 2

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.98(14H,m), 2.20(1H,m), 2.29(2H,t, J=7.2Hz), 3.01(1H,m), 3.67(3H,s), 4.30(
2H,br), 4.79(1H,d, J=6.9Hz), 5.20-5.29(2H,m), 6.71-6.76(2H,m), 7.18(1H,m), 7.37(
1H,dd, J=7.8, 1.2Hz), 7.61-7.65(2H,m), 7.83-7.87(2H,m).

IR(CHCl₃): 3376, 3020, 2946, 2868, 2202, 1725, 1613, 1589, 1484, 1454, 1315, 1253, 1
161/cm.

$[\alpha]_D^{+8.9}$ (CHCl₃, c=1.00, 22°C). mp. 68-70°C

No.1 a - 8 3

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.99(14H,m), 2.17(1H,m), 2.33(2H,t, J=6.9Hz), 2.99(1H,m), 5.20-5.28(2H,m),
5.37(1H,d, J=6.9Hz), 6.45(2H,br), 6.71-6.76(2H,m), 7.19(1H,dd, J=7.8, 6.6Hz), 7.3
7(1H,m), 7.62(2H,d, J=8.4Hz), 7.85(2H,d, J=8.4Hz).

IR(CHCl₃): 3478, 3378, 3260, 3022, 2950, 2868, 2204, 1708, 1613, 1589, 1484, 1454, 1
396, 1316, 1160/cm.

$[\alpha]_D^{+17.1}$ (CHCl₃, c=1.01).

No.1 a - 8 4

CDCl₃ 300MHz

1.00-2.08(14H,m), 2.21(1H,m), 2.37(2H,t, J=6.9Hz), 3.06(1H,m), 3.86(3H,s), 5.29-5.33(2H,m), 5.45(1H,d, J=6.6Hz), 6.91-6.94(2H,m), 7.56-7.59(2H,m), 7.81(1H,d,t, J=8.1Hz), 8.04(1H,d,d, J=8.1&1.8Hz), 8.57(1H,d, J=2.1Hz).

IR(CHCl₃): 3492, 3254, 3028, 2954, 2202, 1708, 1597, 1512, 1344, 1291, 1250/cm.

[α]D=+27.4° (CHCl₃, C=0.53, 23°C).

No.1 a - 8 5

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.05(14H,m), 2.20(1H,m), 2.35(2H,t, J=6.9Hz), 2.99(1H,m), 3.84(3H,s), 5.22-5.31(3H,m), 6.89(2H,d, J=8.7Hz), 7.19(1H,brs), 7.29(1H,brs), 7.45-7.50(3H,m).

IR(CHCl₃): 3478, 3378, 3020, 2950, 2868, 2202, 1708, 1606, 1511, 1421, 1311, 1287, 1248, 1155/cm.

[α]D=+17.1° (CHCl₃, C=1.00, 23°C).

No.1 a - 8 6

CDCl₃ 300MHz

1.03-2.05(14H,m), 2.21(1H,m), 2.37(2H,t, J=6.9Hz), 3.04(1H,m), 5.29-5.33(2H,m), 5.57(1H,d, J=6.3Hz), 6.84-6.87(2H,m), 7.50-7.53(2H,m), 7.79(1H,d, J=8.1Hz), 8.03(1H,d,d, J=1.5 and 8.1Hz), 8.57(1H,d, J=1.5Hz).

IR(CHCl₃): 3250, 3024, 2950, 2868, 2200, 1707, 1515, 1344, 1271, 1166, 1143/cm.

[α]D=+21.2° (CHCl₃, C=0.26, 22°C).

No.1 a - 8 7

CD₃OD 300MHz

1.04-2.00(14H,m), 2.18(1H,m), 2.26(2H,t, J=5.4Hz), 2.93(1H,m), 5.19-5.24(2H,m), 6.77-6.80(2H,m), 7.05(1H,d,d, J=2.1 and 8.1Hz), 7.22(1H,d, J=2.1Hz), 7.38-7.42(3

H,m).

IR(CHCl₃):3377,2952,2873,2204,1705,1607,1515,1425,1312,1267,1222,1153/
cm.

[α]D=-15.6° (CH₃OH,C=1.02,22°C).

No.1 a - 8 8

CDCl₃ 300MHz

0.90-1.96(14H,m),2.22-2.31(3H,m),2.95(1H,m),3.65(3H,s),4.87(1H,d,J=6.6Hz),
5.13-5.28(2H,m),7.46-7.62(3H,m),7.82-7.89(4H,m),7.90-7.96(2H,m),8.42(1H,br
s).

IR(CHCl₃):3376,3016,2946,2868,1720,1677,1592,1514,1498,1429,1376,1314,1
241,1156,1094 /cm.

[α]D= -10.7° (CHCl₃,c=1.04,22.0°C) mp.134-136°C

No.1 a - 8 9

CDCl₃+CD₃OD 300MHz

0.96-2.08(14H,m),2.23(1H,m),2.28(2H,t,J=7.2Hz),2.89(1H,m),5.20-5.32(2H,m),
7.46-7.62(3H,m),7.82-7.97(6H,m).

IR(KBr):3272,3007,2952,2874,1708,1660,1592,1527,1498,1433,1400,1317,126
0,1152,1094 /cm.

[α]D= -24.4° (CH₃OH,c=1.02,25.0°C).

No.1 a - 9 0

CDCl₃ 300MHz

0.89-1.96(14H,m),2.23-2.33(3H,m),2.92(1H,m),3.67(3H,s),4.85(1H,d,J=6.3Hz),
5.10-5.25(2H,m),7.81-7.90(4H,m),8.10-8.18(2H,m),8.31-8.40(2H,m),8.77(1H,s).

IR(CHCl₃):3372,3018,2946,2868,1718,1685,1592,1527,1436,1397,1346,1318,1
256,1154,1099 /cm.

[α]D= -16.1° (CHCl₃,c=1.00,23.0°C).

No.1 a - 9 1

CDCl₃+CD₃OD 300MHz

0.94-2.02(14H,m),2.18-2.36(3H,m),2.87(1H,m),5.15-5.30(2H,m),7.82-7.92(4H,m),8.09-8.16(2H,m),8.30-8.37(2H,m).

IR(KBr):3284,3112,3006,2952,2874,1707,1593,1528,1498,1399,1348,1320,125
9,1153,1093 /cm.

$[\alpha]_D = -26.3^\circ$ (CH₃OH, $c=1.01$, 22°C).

No.1 a - 9 2

5.27(2H,m),6.88-6.98(2H,m),7.54-7.64(2H,m),7.94-8.12(4H,m).

IR(KBr):3370,3006,2953,1708,1649,1604,1541,1512,1460,1441,1414,1328,1302,1248,1162,1107,1090,1032/cm.

$[\alpha]_D = -19.1^\circ$ (CH₃OH,c=1.01,24°C).

No.1 a - 9 5

CD₃OD 300MHz

1.04-2.02(14H,m),2.14(1H,m),2.23(2H,t,J=7.2Hz),2.93-3.02(7H,m),5.13-5.27(2H,m),6.82-6.92(2H,m),7.51-7.59(2H,m),7.95-8.02(2H,m),8.04-8.11(2H,m).

IR(KBr):3370,3006,2953,1708,1649,1604,1541,1512,1460,1441,1414,1328,1302,1248,1162,1107,1090,1032/cm.

$[\alpha]_D = -17.6^\circ$ (CH₃OH,c=1.01,24°C).

No.1 a - 9 6

CD₃OD 300MHz

1.05-2.02(14H,m),2.14(1H,m),2.23(2H,t,J=7.2Hz),2.98(1H,m),5.13-5.27(2H,m),6.75-6.84(2H,m),7.43-7.52(2H,m),7.94-8.12(4H,m).

IR(KBr):3339,3197,2953,2875,1707,1644,1606,1541,1514,1446,1325,1293,1259,1240,1225,1161,1091/cm.

$[\alpha]_D = -18.7^\circ$ (CH₃OH,c=1.00,24°C). mp.193-196°C

No.1 a - 9 7

d₆-DMSO 300MHz

1.05-2.08(15H,m),2.15(2H,t,J=7.5Hz),2.89(1H,m),5.18-5.28(2H,m),6.78-7.12(3H,m),7.73(1H,d,d,J=1.4and7.8Hz),7.91-7.95(3H,m),8.14(2H,d,J=8.4Hz),9.71(1H,s).

IR(KBr):3407,3191,2953,1711,1646,1614,1603,1537,1457,1326,1162,1151/cm

$[\alpha]_D = -20.7^\circ$ (CH₃OH,C=1.01,21°C).

No. 1 a - 9 8

CDCl₃ 300MHz

0.93-2.00(14H,m), 2.21(1H,m), 2.31(2H,t, J=7.2Hz), 2.93(1H,m), 3.84(3H,s), 3.85(6H,s), 5.15-5.30(2H,m), 5.45(1H,d, J=6.3Hz), 7.04(2H,s), 7.78-7.86(2H,m), 7.90-7.98(2H,m), 8.58(1H,s).

IR(CHCl₃): 3264, 3008, 2954, 2874, 1707, 1670, 1607, 1537, 1506, 1451, 1421, 1308, 1158, 1129, 1088/cm.

[α]_D = -7.2° (CHCl₃, C=1.01, 23.5°C). mp. 147-149°C

No. 1 a - 9 9

CD₃OD 300MHz

1.04-1.98(14H,m), 2.21(1H,m), 2.10(2H,t, J=7.2Hz), 2.95(1H,m), 3.76(3H,s), 3.86(6H,s), 5.07-5.24(2H,m), 7.19(2H,s), 7.99(2H,d, J=8.7Hz), 8.13(1H,d, J=8.7Hz).

IR(KBr): 3354, 3002, 2950, 2874, 1656, 1607, 1570, 1508, 1452, 1413, 1314, 1233, 1118, 1157, 1127, 1092/cm.

[α]_D = -20.3° (CH₃OH, C=1.00, 23.5°C).

No. 1 a - 1 0 0

CDCl₃ 300MHz

1.14-1.97(14H,m), 2.19(1H,m), 2.28(2H,t, J=7.4Hz), 3.04(1H,m), 3.69(3H,s), 5.03(1H,d, J=6.9Hz), 5.15-5.29(2H,m), 7.65(2H,d, J=8.4Hz), 7.87(1H,s), 7.98(2H,d, J=8.4Hz).

IR(CHCl₃): 3386, 3271, 3025, 3015, 2955, 2877, 1755, 1712, 1608, 1331, 1162/cm.

[α]_D = -29.4° (CH₃OH, c=1.01, 25°C).

No. 1 a - 1 0 1

d₆-DMSO

1.00-2.20(17H,m), 2.84(1H,m), 5.00-5.20(2H,m), 7.78(2H,d, J=8.2Hz), 7.84(1H,s),

7.89-7.95(3H,m).

IR(KBr):3269,3065,3008,2952,2874,2763,1746,1707,1607,1322,1157 /cm.

$[\alpha]_D = -26.2^\circ$ (CH₃OH, c=1.01, 25°C).

No.1 a - 1 0 2

CD3OD

1.00-2.25(17H,m), 2.92(1H,s), 3.64(3H,s), 5.07-5.21(2H,m), 7.53(1H,s), 7.77(2H,d, J=8.6Hz), 7.90(2H,d, J=8.6).

IR(KBr):3430,3277,3006,2952,2873,1720,1687,1620,1571,1438,1312,1156 /cm.

$[\alpha]_D = -27.3^\circ$ (CH₃OH, c=0.51, 26°C). mp 230-232°C

No.1 a - 1 0 3

CDCl₃ 300MHz

0.94-1.96(14H,m), 2.19(1H,m), 2.28(2H,t, J=7.2Hz), 3.04(1H,m), 3.69(3H,s), 5.11(1H,d, J=6.6Hz), 5.15-5.28(2H,m), 7.60(2H,d, J=8.4Hz), 7.67(1H,s), 7.98(2H,d, J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3381,3021,2955,2876,1735,1605,1437,1411,1325,1231,1177 /cm.

$[\alpha]_D = +8.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 23°C).

No.1 a - 1 0 4

CDCl₃ 300MHz

0.94-1.96(14H,m), 2.21(1H,m), 2.31(2H,t, J=6.8Hz), 2.99(1H,m), 5.18-5.28(2H,m), 5.45(1H,d, J=6.6Hz), 7.61(2H,d, J=8.7Hz), 7.67(1H,s), 7.99(2H,d, J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3382,3222,3028,3019,2957,2876,1736,1709,1604,1412,1322,1301,1286,1179,1162 /cm.

$[\alpha]_D = +10.4^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 23°C).

No.1 a - 1 0 5

CDCl₃ 300MHz

0.92-1.98(14H,m), 2.17(1H,m), 2.26(2H,d, J=7.5Hz), 3.01(1H,m), 3.69(3H,s), 4.01(3H,s), 4.84(1H,d, J=6.3Hz), 5.14-5.30(2H,m), 7.71(2H,d, J=8.7Hz), 7.87(2H,d, J=8.7Hz), 8.09(1H,s).

IR(CHCl₃): 3385, 3284, 3025, 3015, 2954, 2877, 2821, 1730, 1598, 1459, 1438, 1403, 1341, 1160, 1052 /cm.

[α]_D = +3.6° (CHCl₃, c=1.00, 26°C).

No.1 a - 1 0 6

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.08(14H,m), 2.14(1H,m), 2.34(2H,d, J=7.2Hz), 3.02(1H,m), 4.01(3H,s), 5.19(1H,d, J=6.9Hz), 5.23-5.32(2H,m), 7.71(2H,d, J=8.4Hz), 7.88(2H,d, J=8.4Hz), 8.09(1H,s).

IR(CHCl₃): 3510, 3384, 3268, 3028, 3021, 3014, 2957, 2877, 2821, 2667, 2666, 1707, 1598, 1459, 1404, 1341, 1324, 1160, 1052 /cm.

[α]_D = +11.8° (CHCl₃, c=1.01, 25°C). mp 95-96°C

No.1 a - 1 0 7

CDCl₃ 300MHz

0.92-1.97(14H,m), 1.34(3H,t, J=7.2Hz), 2.18(1H,m), 2.28(2H,d, J=7.4Hz), 3.01(1H,m), 3.68(3H,s), 4.26(2H,q, J=7.2Hz), 4.86(1H,d, J=6.6Hz), 5.15-5.29(2H,m), 7.71(2H,d, J=8.7Hz), 7.87(2H,d, J=8.7Hz), 8.09(1H,s).

m), 4.27(2H, q, J=7.2Hz), 5.20(1H, d, J=6.6Hz), 5.21-5.35(2H, m), 7.71(2H, d, J=8.4Hz), 7.88(2H, d, J=8.4Hz), 8.10(1H, s).

IR(CHCl₃): 3514, 3384, 3270, 3025, 3015, 3015, 2957, 2877, 1708, 1599, 1458, 1403, 1324, 1324, 1160, 1050 /cm.

[α]_D = +12.7° (CHCl₃, c=1.00, 25°C).

No.1 a - 1 0 9

[α]_D = +8.5° (CHCl₃, c=1.00, 25°C). mp 109.0-111.0°C

No.1 a - 1 1 0

CDCl₃:CD₃OD(95:5)

0.92-2.06(14H, m), 2.20(1H, m), 2.30(2H, d, J=7.2Hz), 2.99(1H, m), 5.22-5.33(2H, m), 7.54-7.66(3H, m), 8.07(2H, d, J=9.0Hz), 8.12-8.20(2H, m), 8.29(2H, d, J=9.0Hz).

IR(Nujol): 3270, 2956, 2924, 2854, 1716, 1548, 1485, 1319, 1167/cm.

[α]_D = +17.0° (CHCl₃, c=1.00, 25°C). mp 166.5-168°C

No.1 a - 1 1 1

[α]_D = +2.6° (CHCl₃, c=1.00, 24°C). mp 120.0-121.0°C

No.1 a - 1 1 2

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.04(14H, m), 2.19(1H, m), 2.33(2H, d, J=7.1Hz), 3.07(1H, m), 5.28-5.31(2H, m), 5.33(1H, d, J=6.6Hz), 7.54-7.63(3H, m), 8.05(2H, d, J=8.4Hz), 8.18-8.23(2H, m), 8.41(2H, d, J=8.4Hz).

IR(CHCl₃): 3384, 3269, 3025, 3015, 2957, 2877, 1708, 1598, 1496, 1457, 1417, 1326, 1164 /cm.

[α]_D = +12.2° (CHCl₃, c=1.00, 24°C). mp 163-164°C

No.1 a - 1 1 3

$[\alpha]_D = +22.1^\circ$ (CHCl₃, c=1.05, 25°C). mp. 90-92°C

No.1 a - 1 1 4

$[\alpha]_D = +2.2^\circ$ (CHCl₃, c=1.02, 25°C).

No.1 a - 1 1 5

CDCl₃ 300MHz

0.90-1.98(14H, m), 2.15-2.22(1H, m), 2.27(2H, t, J=7.2Hz), 2.95-3.04(1H, m),
3.68(3H, s), 4.04(2H, s), 4.85(1H, d, J=6.6Hz), 5.10-5.27(2H, m), 7.12-
7.34(7H, m), 7.76-7.82(2H, m).

IR(CHCl₃): 3384, 3026, 2952, 1727, 1595, 1493, 1436, 1318, 1155, 1091, 890/cm.

$[\alpha]_D = 0^\circ$

$[\alpha]_{436} = +4.9 \pm 0.4^\circ$ (CHCl₃, c=1.05, 23°C)

No.1 a - 1 1 6

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.10(14H, m), 2.10-2.18(1H, m), 2.32(2H, t, J=7.2Hz), 2.96-3.04(1H, m),
4.04(2H, s), 5.14(1H, d, J=6.6Hz), 5.16-5.28(2H, m), 7.12-7.34(7H, m), 7.76-
7.82(2H, m).

IR(CHCl₃): 3260, 3020, 2950, 1709, 1407, 1318, 1154, 1091, 892/cm.

$[\alpha]_D = +9.1 \pm 0.5^\circ$ (CHCl₃, c=1.04, 23°C)

No.1 a - 1 1 7

CD₃OD 300MHz

0.96-2.18(17H, m), 2.89-2.92(1H, m), 4.05(2H, s), 4.05-5.02(2H, m), 7.12-7.34(7H, m), 7.76-7.82(2H, m).

No.1 a - 1 1 8

CDCl₃ 300MHz

0.98-1.70(15H,m), 1.80-2.00(5H,m), 2.20-2.40(3H,m), 2.98(1H,m), 4.06(2H,s), 4.72(1H,d,J=6.3Hz), 5.00-5.23(3H,m), 7.16(2H,d,J=8.4Hz), 7.26-7.33(5H,m), 7.79(2H,d,J=8.1Hz).

IR(CHCl₃): 3376, 3020, 2948, 2868, 1716, 1596, 1492, 1453, 1407, 1318, 1155, 1105/cm.

[α]_D=+2.4° (CHCl₃, c=1.08, 24°C).

No.1 a - 1 1 9

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.02(14H,m), 2.20(1H,m), 2.29(2H,t,J=7.2Hz), 3.00(1H,m), 3.68(3H,s), 4.86(1H,d,J=6.9Hz), 5.13-5.34(2H,m), 7.00-7.09(4H,m), 7.22(1H,m), 7.37-7.45(2H,m), 7.79-7.86(2H,m).

IR(CHCl₃): 3376, 3018, 2946, 2868, 1727, 1582, 1486, 1321, 1243, 1151, 1093 /cm.

[α]_D= +4.5° (CHCl₃, c=1.05, 23.5°C).

No.1 a - 1 2 0

CD₃OD 300MHz

1.00-2.00(14H,m), 2.13(2H,t,J=7.5Hz), 2.16(1H,m), 2.91(1H,m), 5.05-5.33(2H,m), 7.04-7.11(4H,m), 7.18-7.25(1H,m), 7.38-7.48(2H,m), 7.80-7.87(2H,m).

IR(KBr): 3430, 3278, 3006, 2952, 2873, 1583, 1487, 1410, 1322, 1298, 1245, 1152, 1095 /cm.

[α]_D= -8.8° (CH₃OH, c=1.05, 25.0°C).

No.1 a - 1 2 1

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.10(14H,m), 2.15(1H,m), 2.35(2H,t,J=7.2Hz), 3.01(1H,m), 5.20(1H,d,J=6.9

148,1091 /cm.

$[\alpha]_D = +2.7^\circ$ (CHCl₃, c=1.09, 23.0°C).

No.1 a - 1 2 5

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.00(14H,m), 2.18(1H,m), 2.28(2H,t, J=7.2Hz), 2.29(3H,s), 3.00(1H,m), 3.68(3H,s), 4.04(2H,s), 4.80(1H,d, J=6.6Hz), 5.11-5.29(2H,m), 6.99-7.06(2H,m), 7.12-7.19(2H,m), 7.31(2H,d, J=8.1Hz), 7.79(2H,d, J=8.1Hz).

IR(CHCl₃): 3382, 3280, 3024, 2950, 2874, 1730, 1596, 1504, 1435, 1407, 1367, 1318, 1196, 1155, 1091 /cm.

$[\alpha]_D = +2.9^\circ$ (CHCl₃, c=1.06, 23.0°C).

No.1 a - 1 2 6

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.02(14H,m), 2.14(1H,m), 2.29(3H,s), 2.32(2H,t, J=7.2Hz), 3.01(1H,m), 4.03(2H,s), 5.10(1H,d, J=6.6Hz), 5.15-5.30(2H,m), 6.98-7.06(2H,m), 7.11-7.18(2H,m), 7.30(2H,d, J=8.1Hz), 7.79(2H,d, J=8.1Hz).

IR(CHCl₃): 3374, 3260, 3020, 2948, 2868, 1749, 1708, 1596, 1504, 1407, 1369, 1317, 1195, 1155, 1091 /cm.

$[\alpha]_D = +10.0^\circ$ (CHCl₃, c=1.09, 23.0°C).

No.1 a - 1 2 7

CDCl₃ 300MHz

0.87-1.95(14H,m), 2.18-2.32(3H,m), 2.95(1H,m), 3.69(3H,s), 3.96(2H,s), 4.79(1H,d, J=6.6Hz), 4.97-5.17(2H,m), 5.54(1H,s), 6.75-6.82(2H,m), 6.97-7.05(2H,m), 7.25-7.33(2H,m), 7.75-7.81(2H,m).

IR(CHCl₃): 3382, 3026, 2950, 2874, 1722, 1595, 1511, 1436, 1407, 1317, 1257, 1154, 1090 /cm.

$[\alpha]_D = -2.1^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 21.5°C).

No.1 a - 1 2 8

CDCl₃ 300MHz

0.85-2.02(14H,m),2.18(1H,m),2.31(2H,t,J=7.2Hz),2.96(1H,m),3.95(2H,s),5.05-5.27(3H,m),6.73-6.82(2H,m),6.96-7.04(2H,m),7.25-7.32(2H,m),7.74-7.81(2H,m).

IR(CHCl₃):3262,3020,2948,2868,1708,1596,1511,1407,1315,1242,1154,1091 / cm.

[α]_D=+4.8° (CHCl₃,c=1.04,22°C).

No.1 a - 1 2 9

CDCl₃ 300MHz

0.89-1.98(14H,m),2.18(1H,m),2.27(2H,t,J=7.2Hz),2.99(1H,m),3.68(3H,s),3.79(3H,s),3.98(2H,s),4.81(1H,d,J=6.6Hz),5.10-5.27(2H,m),6.81-6.87(2H,m),7.03-7.10(2H,m),7.25-7.32(2H,m),7.75-7.82(2H,m).

IR(CHCl₃):3382,3276,3006,2950,2874,1726,1609,1509,1457,1436,1407,1315,1244,1154,1091,1033/cm.

[α]_D=+19.3° (CHCl₃,C=1.05,23°C).

No.1 a - 1 3 0

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.00(14H,m),2.20(1H,m),2.30(2H,t,J=7.2Hz),2.98(1H,m),3.69(3H,s),4.81(1H,d,J=6.6Hz),5.12-5.32(2H,m),5.46(1H,brs),6.84-7.01(6H,m),7.76-7.83(2H,m)

IR(CHCl₃):3380,3284,3024,2952,2874,1724,1588,1504,1488,1436,1321,1296,1149,1091/cm.

[α]_D=+28.9° (CHCl₃,C=1.01,23°C).

No.1 a - 1 3 1

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.10(14H,m),2.18(1H,m),2.34(2H,t,J=6.9Hz),2.96(1H,m),5.18-5.35(3H,m),
6.84-7.01(6H,m),7.75-7.83(2H,m).

IR(CHCl₃):3270,3028,2952,2874,1708,1589,1505,1489,1456,1322,1297,1238,1
148,1091/cm.

[α]_D=+7.7° (CHCl₃,C=1.09,24°C).

No.1 a - 1 3 2

CDCl₃ 300MHz

0.91-2.02(14H,m),2.19(1H,m),2.29(2H,t,J=7.2Hz),2.99(1H,m),3.68(3H,s),3.83(
3H,s),4.82(1H,d,J=6.6Hz),5.14-5.33(2H,m),6.90-7.04(6H,m),7.76-7.83(2H,m).

IR(CHCl₃):3384,3006,2952,2874,1727,1589,1502,1488,1459,1438,1321,1295,1
231,1150,1092,1033/cm.

[α]_D=+3.1° (CHCl₃,C=1.01,23°C).

No.1 a - 1 3 3

TLC R_f=0.21 (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 1 (0.3%酢酸))

No.1 a - 1 3 4

CDCl₃ 300MHz

0.97-2.10(14H,m),2.20(1H,m),2.36(2H,t,J=6.9Hz),3.04(1H,m),5.22-5.33(2H,m),
5.41(1H,d,J=6.6Hz),7.02(1H,d,J=9.0Hz),7.09-7.13(2H,m),7.26-7.32(1H,m),7.43
-7.49(2H,m),7.93(1H,d.d,J=2.4and9.0Hz),8.46(1H,d,J=2.4Hz).

IR(CHCl₃):3384,3270,3020,2958,1709,1610,1587,1537,1479,1352,1271,1252,1
167/cm.

[α]_D=+20.9° (CHCl₃,C=0.51,22°C).

No.1 a - 1 3 5

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.02(14H,m),2.21(1H,m),2.29(2H,t,J=7.2Hz),3.07(1H,m),3.68(3H,s),5.04(

1H,d,J=6.9Hz),5.16-5.33(2H,m),7.48-7.55(2H,m),7.64(1H,m),7.76-7.82(2H,m),
7.88-7.94(2H,m),7.98-8.04(2H,m).

IR(CHCl₃):3384,3282,3026,2952,2874,1727,1663,1596,1446,1396,1316,1274,1
163,1090 /cm.

[α]_D= +3.1° (CHCl₃,c=1.03,22.0°C).

No.1 a - 1 3 6

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.05(14H,m),2.19(1H,m),2.34(2H,t,J=7.2Hz),3.08(1H,m),5.10-5.40(2H,m),
5.35(1H,d,J=6.8Hz),7.45-7.58(2H,m),7.64(1H,m),7.74-7.84(2H,m),7.84-7.95(2
H,m),7.95-8.06(2H,m).

IR(CHCl₃):3260,3018,2950,2870,1708,1662,1595,1446,1395,1316,1274,1162,1
090 /cm.

[α]_D= +12.9° (CHCl₃,c=1.05,21.5°C).

No.1 a - 1 3 7

CDCl₃ 300MHz

0.97-2.04(14H,m),2.27(1H,m),2.31(2H,t,J=7.2Hz),3.07(1H,m),3.70(3H,s),5.15-
5.30(3H,m),7.48-7.68(5H,m),7.96-8.02(2H,m).

IR(CHCl₃):3382,3030,2952,2878,1725,1446,1329,1154,1098 /cm.

[α]_D= -12.1° (CHCl₃,c=1.03,22.0°C).

No.1 a - 1 3 8

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.04(14H,m),2.25(1H,m),2.35(2H,t,J=7.2Hz),3.08(1H,m),5.15-5.34(2H,m),
5.41(1H,d,J=6.6Hz),7.48-7.68(5H,m),7.98-8.03(2H,m).

IR(CHCl₃):3370,3242,3022,2950,2870,1707,1445,1408,1329,1154,1099 /cm.

[α]_D=-0.6° (CHCl₃,c=1.06,21.5°C) [α]₃₆₅ +30.7° (CHCl₃,c=1.06,21.5°C).

No.1 a - 1 3 9

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.19(14H,m),2.27-2.34(3H,m),3.26(1H,m),3.65(3H,s),4.28(2H,s),4.37(1H,
d,J=7.4Hz),5.34-5.50(2H,m),7.37-7.62(9H,m).

IR(CHCl₃):3389,3294,3028,3015,2954,2877,1730,1600,1488,1325,1151,1129 /
cm.

$[\alpha]_D = -24.8^\circ$ (CHCl₃,c=1.01,24°C).

No.1 a - 1 4 0

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.22(15H,m),2.34(2H,t,J=7.1Hz),3.24(1H,m),4.29(2H,s),4.81(1H,d,J=7.4H
z),5.32-5.52(2H,m),7.36-7.62(9H,m).

IR(CHCl₃):3510,3388,3251,3031,3015,2956,2877,2668,1708,1601,1488,1318,1
151,1129 /cm.

$[\alpha]_D = -24.6^\circ$ (CHCl₃,c=1.02,25°C).

No.1 a - 1 4 1

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.19(15H,m),2.32(2H,t,J=7.2Hz),3.26(1H,m),3.65(3H,s),4.31(2H,s),4.48(1
H,d,J=7.4Hz),5.33-5.49(2H,m),7.42-7.80(8H,m).

IR(CHCl₃):3388,3285,3018,2955,2877,2225,1730,1597,1479,1320,1152,1129 /
cm.

$[\alpha]_D = -20.1^\circ$ (CHCl₃,c=0.96,25°C).

No.1 a - 1 4 2

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.22(15H,m),2.35(2H,t,J=6.8Hz),3.25(1H,m),4.32(2H,s),4.86(1H,d,J=7.4H
z),5.33-5.53(2H,m),7.43-7.80(8H,m).

IR(CHCl₃):3512,3388,3258,3031,3023,3014,2956 2877,2225,1708,1597,1479,

1319,1151,1128 /cm.

$[\alpha]_D = -19.3^\circ$ (CHCl₃, c=1.09, 23°C).

No.1 a - 1 4 3

CDCl₃ 300MHz

1.00-1.93(14H,m), 2.17(1H,m), 2.27(2H,t, J=7.2Hz), 3.07(1H,m), 5.17-5.22(2H,m), 5.36(1H,d, J=6.9Hz), 7.77(1H,d, J=9.0Hz), 8.11-8.17(2H,m), 8.36(1H,d,d, J=2.1 and 9.0Hz), 8.51(1H,d, J=1.8Hz), 8.65(1H,d, J=2.1Hz).

IR(CHCl₃): 3382, 3266, 3026, 2954, 2874, 1708, 1632, 1585, 1528, 1458, 1419, 1345, 1153/cm.

$[\alpha]_D = +7.6^\circ$ (CHCl₃, C=1.04, 22°C).

No.1 a - 1 4 4

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.90(14H,m), 2.17(1H,m), 2.25(2H,t, J=7.5Hz), 3.02(1H,m), 5.09(1H,d, J=6.6 Hz), 5.15-5.21(2H,m), 6.72(1H,d, J=8.4Hz), 6.85(1H,s), 7.54(1H,d, J=8.4Hz), 7.72(1H,d, J=9.0Hz), 7.83(1H,d,d, J=1.8 and 9.0Hz), 8.32(1H,d, J=1.8Hz).

IR(CHCl₃): 3380, 3260, 3022, 2948, 2868, 2352, 1709, 1636, 1460, 1425, 1313, 1291, 1265, 1148, 1130/cm.

$[\alpha]_D = +12.9^\circ$ (CHCl₃, C=1.02, 22.5°C).

No.1 a - 1 4 5

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.90(14H,m), 2.15(1H,m), 2.27(2H,t, J=6.9Hz), 3.02(1H,m), 3.08(6H,s), 5.12(1H,d, J=6.3Hz), 5.19-5.25(2H,m), 6.78-6.84(2H,m), 7.53(1H,d, J=8.7Hz), 7.76-7.83(2H,m), 8.30(1H,d, J=1.8Hz).

IR(CHCl₃): 3272, 3030, 2950, 2874, 1708, 1635, 1601, 1511, 1457, 1425, 1357, 1328, 1151, 1124/cm.

$[\alpha]_D = +6.3^\circ$ (CHCl₃, C=1.04, 23°C).

No.1 a - 1 4 6

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.00(14H,m),2.16(1H,m),2.29(2H,t,J=7.2Hz),3.05(1H,m),4.10(3H,s),5.13-5.28(2H,m),5.38(1H,d,J=6.9Hz),7.67-7.74(2H,m),8.08(1H,d,d,J=1.8and9.0Hz),8.11(1H,s),8.61(1H,d,J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3260,3020,2948,2868,1708,1639,1606,1528,1470,1455,1424,1349,1311,1238,1174,1149,1120,1079,1060,1022/cm.

[α]D=+7.8° (CHCl₃,C=1.00,23°C).

No.1 a - 1 4 7

CDCl₃ 300MHz

0.92-1.92(14H,m),2.17(1H,m),2.25(2H,t,J=7.2Hz),3.01(1H,m),3.97(3H,s),5.10-5.27(5H,m),6.92(1H,s),7.29(1H,s),7.52(1H,d,J=8.7Hz),7.82(1H,d,d,J=2.1and8.7Hz),8.33(1H,d,J=2.1Hz).

IR(CHCl₃):3380,3264,3002,2950,2868,1708,1634,1476,1452,1426,1317,1264,1218,1169,1147,1115,1068,1031/cm.

[α]D=+5.6° (CHCl₃,C=1.02,23°C).

No.1 a - 1 4 8

CDCl₃ 300MHz

0.90-1.98(14H,m),2.15(1H,m),2.28(2H,t,J=6.9Hz),2.91(6Hs),3.03(1H,m),4.01(3H,s),5.15-5.26(3H,m),7.18(1H,s),7.38(1H,s),7.59(1H,d,J=8.7Hz),7.87(1H,d,d,J=2.1and8.7Hz),8.40(1H,d,J=2.1Hz).

IR(CHCl₃):3384,3266,2956,1709,1632,1602,1495,1473,1458,1430,1317,1231,1148,1121/cm.

[α]D=+11.2° (CHCl₃,C=1.01,23°C).

N .1 a - 1 4 9

CDCl₃ 300MHz

0.99-1.90(14H,m), 2.17(1H,m), 2.28(2H,t, J=7.2Hz), 3.00(1H,m), 5.13-5.19(2H,m),
5.43(1H,d, J=6.0Hz), 7.02(1H,d,d, J=2.4 and 9.0Hz), 7.38-7.41(2H,m), 7.58(1H,d, J
=8.7Hz), 7.96(1H,d,d, J=1.8 and 8.7Hz), 8.45(1H,d, J=1.8Hz).

IR(CHCl₃): 3270, 3020, 2948, 2868, 1709, 1601, 1478, 1448, 1419, 1315, 1147, 1120/
cm.

[α]_D = -11.4° (CHCl₃, C=1.01, 23°C).

No.1 a - 1 5 0

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.88(14H,m), 2.12-2.31(3H,m), 2.38(3H,s), 3.01(1H,m), 5.14-5.19(2H,m), 5.3
6(1H,d, J=6.6Hz), 7.24(1H,d,d, J=2.4 and 9.0Hz), 7.59(1H,d, J=6.3Hz), 7.66(1H,d, J
=8.7Hz), 7.72(1H,d, J=2.4Hz), 8.01(1H,d,d, J=1.8 and 8.7Hz), 8.49(1H,d, J=1.8Hz).

IR(CHCl₃): 3470, 3374, 3260, 3018, 2950, 2868, 1709, 1474, 1444, 1412, 1370, 1319, 1
266, 1162, 1145, 1118/cm.

[α]_D = +4.9° (CHCl₃, C=1.00, 24°C).

No.1 a - 1 5 1

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.89(14H,m), 2.17(1H,m), 2.25(2H,t, J=7.2Hz), 3.03(1H,m), 3.92(3H,s), 5.15-
5.20(2H,m), 5.32(1H,d, J=6.6Hz), 7.11(1H,d,d, J=2.4 and 9.3Hz), 7.45(1H,d, J=2.4
Hz), 7.50(1H,d, J=9.3Hz), 7.62(1H,d, J=8.7Hz), 7.97(1H,d,d, J=2.1 and 8.7Hz), 8.50(
1H,d, J=2.1Hz).

IR(CHCl₃): 3260, 3018, 2948, 1708, 1483, 1454, 1432, 1314, 1287, 1268, 1188, 1160, 1

0.98-2.04(14H,m),2.15(1H,m),2.30(2H,t,J=6.6Hz),3.04(1H,m),5.17-5.29(3H,m),
7.41(1H,d,d,J=1.5and8.1Hz),7.64-7.68(2H,m),7.92(1H,d,J=8.4Hz),8.00(1H,d,d,
J=1.8and8.4Hz),8.49(1H,d,J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3266,3028,2952,2872,1707,1629,1591,1456,1416,1318,1275,1150/c
m.

$[\alpha]_D = +3.2^\circ$ (CHCl₃, C=1.04, 23°C).

No.1 a - 1 5 3

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.88(14H,m),2.16(1H,m),2.26(2H,t,J=7.2Hz),3.03(1H,m),4.64-4.65(2H,m),
5.16-5.50(5H,m),6.13(1H,m),7.14(1H,d,d,J=2.7and9.0Hz),7.46-7.52(2H,m),7.6
3(1H,d,J=8.7Hz),7.97(1H,d,d,J=1.8and8.7Hz),8.49(1H,d,J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3374,3260,3020,2948,2868,1708,1599,1478,1446,1414,1314,1284,1
268,1184,1148,1120/cm.

$[\alpha]_D = +5.3^\circ$ (CHCl₃, C=1.00, 23°C).

No.1 a - 1 5 4

CDCl₃ 300MHz

0.99-2.00(15H,m),2.26(2H,t,J=7.2Hz),3.03(1H,m),4.07(3H,s),5.23-5.27(2H,m),
5.36(1H,d,J=7.2Hz),7.20(1H,s),7.36-7.48(2H,m),7.55-7.58(1H,m),7.91-7.93(1H,
m),8.52(1H,s).

IR(CHCl₃):3362,3257,3020,2948,2868,1708,1637,1602,1579,1488,1457,1437,1
413,1345,1318,1301,1276,1182,1104/cm.

$[\alpha]_D = +19.4^\circ$ (CHCl₃, C=1.01, 25°C).

mp.88-90°C

No.1 a - 1 5 5

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.02(14H,m),2.15(1H,m),2.31(2H,t,J=7.2Hz),3.01(1H,m),4.10(2H,s),5.10(

1H,d,J=6.6Hz),5.18-5.35(2H,m),7.04-7.26(5H,m),7.67-7.76(2H,m).

IR(CHCl₃):3266,3028,2952,2952,2872,1708,1599,1574,1478,1457,1418,1301,1258,1147,1124,1101,1080/cm.

[α]₃₆₅ +33.4° (CHCl₃,C=1.00,23°C).

No.1 a - 1 5 6

CDCl₃ 300MHz

0.91-2.21(15H,m),2.33(2H,t,J=6.9Hz),3.01(1H,m),5.11(1H,d,J=6.6Hz),5.27-5.35(2H,m),6.85-6.96(5H,m),7.35(1H,d,J=2.1Hz),7.42(1H,d,d,J=2.1and8.7Hz).

IR(CHCl₃):3384,3263,2957,1708,1587,1489,1462,1416,1290,1222,1151,1123/cm.

[α]_D =+6.4° (CHCl₃,C=1.00,23°C).

No.1 a - 1 5 7

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.91(14H,m),2.18(1H,m),2.26(2H,t,J=6.9Hz),3.04(1H,m),5.18-5.26(3H,m),7.52-7.56(2H,m),7.88-8.00(3H,m),8.25(1H,m),8.69(1H,m).

IR(CHCl₃):3382,3268,2952,2874,1707,1457,1425,1409,1318,1152/cm.

[α]_D =+4.4° (CHCl₃,C=1.02,22°C).

No.1 a - 1 5 8

CDCl₃ 300MHz

1.02-1.97(14H,m),2.20(1H,m),2.29(2H,t,J=7.2Hz),3.06(1H,m),5.19-5.24(2H,m),5.58(1H,d,J=6.6Hz),7.62(1H,m),7.72(1H,m),7.86-7.91(2H,m),7.96(1H,d,J=7.8Hz),8.04(1H,d,d,J=1.5and8.1Hz),8.34(1H,d,J=1.2Hz).

IR(CHCl₃):3490,3260,3020,2950,2870,1707,1456,1399,1312,1165/cm.

[α]_D =-8.3° (CHCl₃,C=1.00,23°C).

No.1 a - 1 5 9

CDCI₃ 300MHz

0.92-1.88(14H,m), 2.13(1H,m), 2.24(2H,m), 3.02(1H,m), 3.90(3H,s), 5.12-5.26(3H,m), 7.29-7.58(4H,m), 7.97(1H,d,d, J=1.8 and 7.5Hz), 8.13(1H,d, J=7.5Hz), 8.64(1H,d, J=1.8Hz).

IR(CHCl₃): 3382, 3266, 3018, 2956, 1708, 1629, 1594, 1476, 1467, 1325, 1245, 1227, 1158, 1146/cm.

[α]_D=+14.6° (CHCl₃, C=1.00, 22°C).

No.1 a - 1 6 0

CDCI₃ 300MHz

0.93-1.88(14H,m), 2.18-2.24(3H,m), 3.00(1H,m), 5.08-5.21(3H,m), 7.28-7.33(1H,m), 7.47-7.51(3H,m), 7.90(1H,d,d, J=1.5 and 7.8Hz), 8.10(1H,d, J=7.8Hz), 8.63-8.64(2H,m).

IR(CHCl₃): 3465, 3380, 3275, 3020, 2957, 2876, 1708, 1627, 1604, 1495, 1473, 1457, 1328, 1240, 1222, 1156, 1149/cm.

[α]_D=+8.2° (CHCl₃, C=1.01, 22°C).

No.1 a - 1 6 1

CDCI₃ 300MHz

0.98-1.88(14H,m), 2.17(1H,m), 2.24(2H,t, J=7.2Hz), 3.05(1H,m), 5.16-5.20(2H,m), 5.35(1H,d, J=6.6Hz), 7.40(1H,m), 7.55(1H,m), 7.63(1H,d, J=8.1Hz), 7.89(1H,d,d, J=1.5 and 8.1Hz), 8.01(1H,m), 8.06(1H,d, J=8.1Hz), 8.12(1H,d, J=1.5Hz).

IR(CHCl₃): 3478, 3266, 3028, 2952, 2874, 1708, 1454, 1417, 1323, 1196, 1148/cm.

[α]_D=+21.9° (CHCl₃, C=1.01, 23°C).

No.1 a - 1 6 2

CDCI₃ 300MHz

0.96-1.98(14H,m), 2.02(1H,m), 2.25(2H,t, J=7.2Hz), 3.05(1H,m), 4.10(3H,s), 5.14-5.25(2H,m), 5.41(1H,d, J=7.2Hz), 7.35-7.42(1H,m), 7.51-7.64(3H,m), 7.94-8.00(1

H,m),8.16(1H,s).

IR(CHCl₃):3368,3274,3028,2952,2874,1708,1633,1583,1465,1452,1438,1413,1315,1151,1103,1053,1024/cm.

[α]_D= +15.1° (CHCl₃,C=1.01,23°C). mp.108-110°C

No.1 a - 1 6 3

d₆-DMSO 300MHz

0.97-1.84(14H,m),1.92(1H,m),2.04(2H,t,J=7.5Hz),2.90(1H,m),5.08-5.23(2H,m),7.32(1H,s),7.38-7.61(2H,m),7.62(1H,s)7.68-7.71(1H,m),7.92(1H,s),8.14-8.17(1H,m),10.7(1H,s),11.9(1H,s).

IR(KBr):3350,3295,2952,2874,1707,1636,1601,1466,1431,1389,1315,1251,1174,1146,1106/cm.

[α]_D= -25.3° (CH₃OH,C=1.01,25°C). mp.159-162°C

No.1 a - 1 6 4

CDCl₃ 300MHz

0.98-1.96(17H,m),2.05(1H,m),2.25(2H,t,J=7.2Hz),3.07(1H,m),4.32(2H,q,J=7.2Hz),5.19-5.23(2H,m),5.31(1H,d,J=7.8Hz),7.38(1H,m),7.41-7.62(3H,m),7.95(1H,m),8.15(1H,s).

IR(CHCl₃):3360,3018,2946,2870,1709,1633,1457,1445,1425,1394,1314,1176,1152,1105/cm.

[α]_D= +12.7° (CHCl₃,C=1.02,25°C). mp.108-109°C

No.1 a - 1 6 5

CDCl₃ 300MHz

0.95-1.98(15H,m),2.26(2H,t,J=7.5Hz),3.04(1H,m),4.15(3H,s),5.20-5.26(2H,m),5.34(1H,d,J=6.9Hz),7.41-7.47(1H,m),7.65-7.68(2H,m),7.89-7.92(1H,m),8.32(1H,s).

IR(CHCl₃):3366,3087,3022,2957,1708,1632,1538,1463,1408,1364,1346,1308,1

227,1212,1205,1167/cm.

$[\alpha]_D = +19.6^\circ$ (CHCl₃, C=1.01, 25°C).

No.1 a - 1 6 6

CDCl₃ 300MHz

0.97-2.02(15H,m), 2.27(2H,t, J=6.9Hz), 3.07(1H,m), 4.14(3H,s), 5.21-5.27(2H,m),
5.47(1H,d, J=6.9Hz), 7.64(1H,s), 7.72(1H,d,d, J=0.6 and 9.0Hz), 8.25(1H,s), 8.47(1
H,d,d, J=2.4 and 9.0Hz), 8.94(1H,d,d, J=0.6 and 2.4Hz).

IR(CHCl₃): 3373, 2957, 1708, 1639, 1587, 1528, 1467, 1428, 1415, 1345, 1221, 1184, 1
155/cm.

$[\alpha]_D = +14.4^\circ$ (CHCl₃, C=0.50, 25°C)

No.1 a - 1 6 7

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.00(14H,m), 2.15(1H,m), 2.27(2H,t, J=7.2Hz), 3.04(1H,m), 3.97(2H,s), 5.15-
5.30(3H,m), 7.35-7.47(2H,m), 7.55-7.63(1H,m), 7.80-7.96(3H,m), 8.05(1H,d, J=0.3
Hz).

IR(CHCl₃): 3260, 3020, 2948, 2868, 1707, 1451, 1413, 1319, 1172, 1144, 1101, 1071/c
m.

$[\alpha]_D = +18.2^\circ$ (CHCl₃, C=1.04, 22°C).

No.1 a - 1 6 8

CDCl₃ 300MHz

0.90-1.88(14H,m), 2.16(1H,m), 2.25(2H,t, J=6.9Hz), 3.00(1H,m), 5.00-5.19(2H,m),
5.35(1H,d, J=6.6Hz), 7.25-7.30(1H,m), 7.48-7.50(2H,m), 7.73(1H,d,d, J=1.5 and 8.
1Hz), 8.08-8.14(3H,m), 8.93(1H,s).

IR(CHCl₃): 3466, 3380, 3276, 3016, 2957, 1708, 1630, 1495, 1458, 1324, 1241, 1150/c
m.

$[\alpha]_D = +18.0^\circ$ (CHCl₃, C=1.00, 22°C).

No.1 a - 1 6 9

CDCl₃ 300MHz

0.87-1.86(14H,m), 2.15(1H,m), 2.25(2H,t, J=6.9Hz), 2.98(1H,m), 3.89(3H,s), 5.00-5.22(2H,m), 5.27(1H,d, J=6.9Hz), 6.88(1H,d,d, J=2.1 and 8.4Hz), 6.94(1H,d, J=2.1 Hz), 7.69(1H,d,d, J=1.5 and 7.8Hz), 7.92-8.01(3H,m), 8.83(1H,s).

IR(CHCl₃): 3465, 3378, 3276, 3022, 2957, 1708, 1630, 1609, 1569, 1459, 1433, 1314, 1281, 1229, 1151/cm.

[α]_D=+19.3° (CHCl₃, C=1.01, 21°C).

No.1 a - 1 7 0

CDCl₃ 300MHz

0.88-2.25(17H,m), 3.04(1H,m), 3.84(3H,s), 3.95(3H,s), 5.06-5.26(3H,m), 6.87-6.93(2H,m), 7.69(1H,d,d, J=1.6 and 8.2Hz), 7.93-9.05(3H,m).

IR(CHCl₃): 3026, 2957, 1708, 1630, 1601, 1460, 1331, 1243, 1224, 1152/cm.

[α]_D=+17.2° (CHCl₃, C=1.00, 22°C).

No.1 a - 1 7 1

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.00(14H,m), 2.16-2.32(3H,m), 2.66(3H,s), 3.14(1H,m), 3.68(3H,s), 5.09(1H,d, J=6.8Hz), 5.10-5.28(2H,m), 7.45(1H,d,d, J=1.8 & 8.6Hz), 7.75-7.84(2H,m).

IR(CHCl₃): 3374, 3018, 2946, 2868, 1725, 1585, 1513, 1436, 1340, 1278, 1153, 1112 / cm.

[α]_D= -14.7° (CHCl₃, c=1.07, 25.0°C).

No.1 a - 1 7 2

CDCl₃ 300MHz

0.97-2.02(14H,m), 2.23(1H,m), 2.28(2H,t, J=7.2Hz), 2.66(3H,s), 3.14(1H,m), 5.12-5.22(2H,m), 5.41(1H,d, J=7.2Hz), 7.45(1H,d,d, J=2.1 & 8.7Hz), 7.76(1H,d, J=8.7Hz)

), 7.78(1H, d, J=2.1Hz).

IR(CHCl₃): 3372, 3250, 3022, 2950, 2868, 1707, 1514, 1419, 1336, 1279, 1154, 1112 / cm.

[α]_D = -4.1° (CHCl₃, c=1.08, 26.0°C) m.p. 141-143°C

No. 1 a - 1 7 3

CDCl₃ 300MHz

1.15-2.42(17H, m), 2.91(1H, m), 5.15(1H, d, J=4.2Hz), 5.25-5.40(2H, m), 7.85(1H, t, J=7.2Hz), 8.00(1H, t, J=8.1Hz), 8.15-8.20(2H, m), 8.67(1H, d, J=8.1Hz), 8.73(1H, d, J=8.1Hz), 8.83(1H, s), 9.43(1H, s).

IR(KBr): 3422, 3269, 3046, 2952, 2871, 1711, 1617, 1447, 1333, 1243, 1161, 1146/cm.

[α]_D = -41.0° (CH₃OH, C=1.01, 23°C).

No. 1 a - 1 7 4

CDCl₃+d₆-DMSO 300MHz

1.00-1.92(14H, m), 2.20(2H, t, J=6.6Hz), 2.35(1H, m), 2.92(1H, m), 5.05-5.22(2H, m), 6.63(1H, d, J=5.4Hz), 7.77-7.92(3H, m), 8.31(1H, d, d, J=1.8 and 8.7Hz), 8.59(1H, d, J=8.7Hz), 8.73(1H, d, J=8.7Hz), 9.01(1H, s), 9.55(1H, d, J=1.8Hz).

IR(KBr): 3433, 3252, 2952, 2871, 1696, 1578, 1423, 1335, 1308, 1219, 1185, 1160, 1106/cm.

[α]_D = -19.3° (DMSO, C=0.50, 23°C).

No. 1 a - 1 7 5

CDCl₃ 300MHz

0.96-1.87(14H, m), 2.20-2.25(3H, m), 2.95(1H, m), 3.66(3H, s), 4.74(1H, d, J=6.6Hz), 5.10-5.12(2H, m), 6.88(1H, d, J=1.2Hz), 7.37-7.50(3H, m), 7.56(1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.68-7.77(3H, m), 8.06(1H, s), 9.44(1H, dd, J=1.2Hz).

IR(CHCl₃): 3462, 3374, 3026, 3006, 2952, 2872, 1724, 1610, 1580, 1484, 1452, 1358, 1

309,1147.

$[\alpha]_D = +16.4^\circ$ (CHCl_3 , $c=1.05$, 26°C). mp. $130-132^\circ\text{C}$.

No.1 a - 1 7 6

$\text{CDCl}_3 + \text{CD}_3\text{OD}$ 300MHz

1.00-2.02(14H,m), 2.22(1H,m), 2.29(2H,t, $J=6.9\text{Hz}$), 2.88(1H,m), 5.16-5.26(2H,m), 6.87(1H,s), 7.28-7.57(4H,m), 7.69(1H,d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.75-7.78(2H,m), 7.99(1H,s).

IR(KBr): 3254, 2944, 1704, 1484, 1453, 1358, 1305, 1147.

$[\alpha]_D = +13.0^\circ$ (CH_3OH , $c=1.02$, 24°C), mp. $160-161^\circ\text{C}$

No.1 a - 1 7 7

CDCl_3 300MHz

0.96-1.88(14H,m), 1.88-2.26(3H,m), 2.94(1H,m), 3.67(3H,s), 3.87(3H,s), 4.67(1H, brs), 5.08-5.14(2H,m), 6.77(1H,d, $J=1.5\text{Hz}$), 6.99-7.02(2H,m), 7.53-7.57(1H,m), 7.65-7.70(3H,m), 8.00(1H,s), 9.27(1H, brs).

IR(CHCl_3): 3426, 3376, 3006, 2952, 1724, 1610, 1495, 1438, 1357, 1308, 1282, 1249, 1177, 1147/cm.

$[\alpha]_D = +18.1^\circ$ (CHCl_3 , $C=1.02$, 22°C).

No.1 a - 1 7 8

$\text{CDCl}_3 + \text{CD}_3\text{OD}$ 300MHz

0.96-1.91(14H,m), 2.19(1H,m), 2.27(2H,t, $J=6.0\text{Hz}$), 2.85(1H,m), 3.87(3H,s), 5.16-5.23(2H,m), 6.99-7.02(2H,m), 7.41(1H,m), 7.64-7.73(3H,m), 7.92(1H,m).

IR(CHCl_3): 3366, 3261, 3004, 2954, 2873, 1705, 1611, 1496, 1458, 1438, 1304, 1286, 1253, 1180, 1149, 1128/cm.

$[\alpha]_D = +14.6^\circ$ (CHCl_3 , $C=1.02$, 22°C).

0.96-1.87(14H,m),2.15-2.23(3H,m),2.93(1H,m),3.85(3H,s),5.10-5.16(2H,m),6.9
0-6.93(2H,m),7.50(1H,m),7.60-7.65(3H,m),7.91(1H,d,J=0.9Hz).

IR(CHCl₃):3369,3270,2950,2873,1719,1612,1498,1456,1440,1359,1306,1269,1
219,1146,1127/cm.

[α]_D=+18.1° (CH₃OH,C=1.00,22°C).

No.1 a - 1 8 0

CDCl₃+CD₃OD 300MHz

1.03-1.86(14H,m),2.08-2.17(3H,m),2.91(1H,m),5.06-5.10(2H,m),6.76(1H,m),6.8
6-6.90(2H,m),7.48(1H,m),7.61-7.69(3H,m),7.89(1H,m).

IR(CHCl₃):3360,3259,2954,2873,1706,1612,1497,1457,1360,1306,1272,1230,1
176,1148,1126/cm.

[α]_D=+20.3° (CH₃OH,C=1.00,22°C).

No.1 a - 1 8 1

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.96(14H,m),2.15(1H,m),2.29(2H,t,J=6.9Hz),3.05(1H,m),3.81(3H,s),5.08(
1H,d,J=6.9Hz),5.23-5.25(2H,m),6.62(1H,s),7.47-7.54(5H,m),7.59(1H,m),7.70(1
H,m),7.97(1H,m).

IR(CHCl₃):3380,3260,3020,2946,2868,1708,1466,1388,1328,1149/cm.

[α]_D=+32.9° (CHCl₃,c=1.07,22°C).

No.1 a - 1 8 2

CDCl₃ 300MHz

0.94-1.90(14H,m),2.25(2H,t,J=7.5Hz),2.30(1H,m),2.98(1H,m),3.70(3H,s),4.83(
1H,d,J=6.6Hz),5.13-5.16(2H,m),6.95(1H,d,J=1.5Hz),7.11-7.23(2H,m),7.43(1H,
d,J=8.1Hz),7.65(1H,d,J=8.1Hz),7.79-7.93(4H,m),9.08(1H,br).

IR(CHCl₃):3458,3372,3020,3002,2946,2868,1719,1598,1452,1422,1321,1300,1
157/cm.

$[\alpha]_D = -6.6^\circ$ ($\text{CHCl}_3, c=1.00$), mp 150-151°C

No.1 a - 1 8 3

CDCl_3 300MHz

0.95-1.94(14H,m), 2.26(1H,m), 2.28(2H,t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.00(1H,m), 5.16-5.19(2H,m),
5.32(1H,d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.93(1H,d, $J=1.2\text{Hz}$), 7.13(1H,m), 7.22(1H,dd, $J=7.8, 6.6\text{Hz}$),
7.42(1H,d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.63(1H,d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.76(2H,d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.90(2H,d, $J=8.4\text{Hz}$),
8.95(1H,br).

IR(CHCl_3): 3458, 3374, 3260, 3020, 3002, 2948, 2868, 1708, 1598, 1452, 1422, 1301, 1156/cm.

$[\alpha]_D = +17.9^\circ$ ($\text{CHCl}_3, c=1.01, 22^\circ\text{C}$).

No.1 a - 1 8 4

CDCl_3 200MHz

0.92-2.00(14H,m), 2.20(1H,m), 2.34(2H,t, $J=6.8\text{Hz}$), 3.05(1H,m), 5.20-5.36(3H,m),
7.39-7.44(2H,m), 7.61-7.66(1H,m), 7.80-7.84(1H,m), 8.05(2H,d, $J=8.6\text{Hz}$), 8.40(2H,d, $J=8.6\text{Hz}$).

IR(CHCl_3): 3384, 3271, 3019, 2958, 1709, 1615, 1599, 1551, 1453, 1405, 1344, 1326, 1243, 1163/cm.

$[\alpha]_D = +18.5^\circ$ ($\text{CHCl}_3, C=1.00, 21^\circ\text{C}$).

No.1 a - 1 8 5

CDCl_3 300MHz

0.89-2.20(15H,m), 2.26(2H,d,t, $J=2.1$ and 7.2Hz), 2.99(1H,m), 5.08(1H,d, $J=6.3\text{Hz}$),
5.09-5.24(2H,m), 6.90(1H,d, $J=1.2\text{Hz}$), 7.32-7.48(4H,m), 7.64-7.72(3H,m), 8.20(1H,d, $J=1.2\text{Hz}$), 9.00(1H,s).

IR(CHCl_3): 3464, 3375, 3275, 3022, 2956, 1707, 1605, 1490, 1449, 1356, 1322, 1219, 1147, 1131/cm.

$[\alpha]_D = +21.6^\circ$ ($\text{CHCl}_3, C=1.01, 23^\circ\text{C}$).

No.1 a - 1 8 6

CDCl₃:300MHz

1.36-2.24(14H,m),2.31(2H,t,J=7.4Hz),2.49(1H,bs),3.37(1H,m),3.67(3H,s),5.38-5.50(2H,m),7.40-7.68(9H,m).

IR(CHCl₃):3375,1727,1602,1435,1362,1221,1207,1168,1045/cm.

No.1 a - 1 8 7

CDCl₃:300MHz

1.10-2.25(14H,m),2.36(2H,t,J=7.2Hz),2.47(1H,m),3.37(1H,m),5.35-5.54(2H,m),5.62(1H,d,J=7.2Hz),7.39-7.70(9H,m).

IR(CHCl₃):3674,3496,3376,3234,3012,2952,2880,2650,1725(sh),1709,1602,1485,1420,1360,1167/cm.

[α]_D=+32° (CHCl₃,c=1.69).

No.1 a - 1 8 8

CDCl₃ 200MHz

0.86-1.92(14H,m),2.22(3H,m),2.36(3H,s),2.95(1H,m),3.67(3H,s),3.93(3H,s),4.81(1H,d,J=6.2Hz),5.04-5.20(2H,m),7.02-7.05(2H,m),7.31(1H,d,J=8.6Hz),7.39(1H,d,J=7.8Hz),7.79-7.89(3H,m).

IR(CHCl₃):3385,3286,3029,3019,3015,2954,2877,1718,1617,1598,1567,1507,1311,1269,1153 /cm.

[α]_D= -29.4° (CHCl₃,c=1.01,25°C).

No.1 a - 1 8 9

[α]_D=-7.7° (CHCl₃,c=1.00,24°C).

No.1 a - 1 9 0

[α]_D=-17.3° (CHCl₃,c=1.00,24°C).

No.1 a - 1 9 1

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.20(14H,m),2.30(1H,m),2.36(2H,d,J=6.9Hz),3.21(1H,m),4.25(2H,s),5.07(1H,d,J=7.8Hz),5.35-5.48(2H,m),7.25(1H,dd,J=1.8 and 8.1Hz),7.32-7.35(2H,m),7.59(1H,d,J=8.1Hz),7.94(1H,s),8.14(1H,d,J=2.7Hz),8.23(1H,d,d,J=2.7and8.7 Hz).

IR(CHCl₃):3386,3026,3015,2957,2877,2633,1702,1617,1573,1530,1348,1123 / cm.

[α]D= -6.1° (CHCl₃,c=1.01,25°C).

No.1 a - 1 9 2

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.20(14H,m),2.13(3H,m),3.23(1H,m),3.64(3H,s),3.94(3H,s),4.22(2H,s),4.36(1H,d,J=7.8Hz),5.37-5.42(2H,m),7.16-7.42(6H,m),7.53(1H,d,J=8.4Hz),7.94(1H,s).

IR(CHCl₃):3389,3022,3013,2953,2877,1716,1616,1560,1485,1340,1326,1124 / cm.

[α]D= -15.2° (CHCl₃,c=1.01,25°C).

No.1 a - 1 9 3

CDCl₃ 300MHz

0.92-2.20(14H,m),2.25(1H,m),2.35(2H,t,J=7.2Hz),3.17(1H,m),4.22(2H,s),4.91(1H,d,J=7.5Hz),5.37-5.42(2H,m),7.13-7.43(6H,m),7.60(1H,d,J=8.1Hz),8.05(1H,s).

IR(CHCl₃):3511,3387,3029,3020,3011,2957,2877,2651,1698,1614 1560 1505 1

No.1b-1

CDCl₃ 300MHz

0.98-1.56(15H,m),1.85-1.90(5H,m),2.23(1H,m),3.05(1H,m),3.66(3H,s),4.77(1H,
d,J=6.0Hz),5.08-5.28(2H,m),7.46(3H,m),7.38-7.54(2H,d,J=7.5Hz),7.72(2H,d,J=
8.4Hz),7.93(2H,d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3384,3028,2952,2876,1719,1595,1391,1322,1155/cm.

[α]_D436 +4.0~+6.0(CHCl₃,c=1.00,23°C).

mp.96-98°C

No.1b-2

CDCl₃ 300MHz

0.98-1.52(15H,m),1.85-1.90(5H,m),2.17(1H,m),3.00(1H,m),3.67(3H,s),4.05(2H,
s),4.83(1H,d,J=6.0Hz),5.05-5.23(2H,m),7.14(2H,d,J=7.2Hz),7.17-7.32(5H,m),7.
78(2H,d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3384,3026,2952,2874,1719,1595,1453,1407,1320,1180/cm.

[α]_D+2.5° (CHCl₃,c=1.02,24°C).

No.1b-3

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.05(20H,m),2.07(1H,m),3.07(1H,m),4.04(2H,s),5.21-5.35(2H,m),5.55(1H,
d,J=6.9Hz),7.14(2H,d,J=6.6Hz),7.20-7.32(5H,m),7.78(2H,d,J=8.1H).

IR(CHCl₃):3250,3022,2950,1699,1596,1495,1453,1405,1318,1153/cm.

[α]_D+17.1° (CHCl₃,c=1.01,25°C).

mp.129-131°C.

No.1b-4

CDCl₃ 200MHz

0.90-2.10(15H,m),1.19(3H,s),1.20(3H,s),3.11(1H,m),5.24-5.32(2H,m),5.70(1H,
d,J=6.6Hz),7.38-7.68(4H,m),7.96-8.04(2H,m),8.53(1H,d,J=1.4Hz).

IR(CHCl₃):3384,3246,2958,1701,1632,1595,1468,1445,1322,1216,1202,1190,1155,1122/cm.

[α]D=+10.8° (CHCl₃,C=0.51,23°C).

No.1b-5

1.02-2.10(15H,m),1.16(6H,s),3.02(1H,m),4.09(3H,s),5.23-5.28(2H,m),5.76(1H,d,J=7.2Hz),7.36-7.63(4H,m),7.97(1H,d,J=7.8Hz),8.16(1H,s).

IR(CHCl₃):3369,2959,1702,1635,1585,1468,1454,1441,1415,1318,1222,1189,1170,1154/cm.

[α]D=+9.9° (CHCl₃,C=1.00,23°C).

No.1c-1

CDCl₃ 300MHz

1.10-2.02(14H,m),2.27(2H,t,J=7.5Hz),2.50(1H,m),2.89(3H,s),3.31(1H,m),3.64(3H,s),5.16-5.30(2H,m),7.34-7.42(3H,m),7.50-7.59(2H,m),7.62-7.68(2H,m),7.76-7.82(2H,m).

IR(CHCl₃):3020,2946,2868,2212,1727,1596,1495,1437,1339,1156,1135,1084 /cm.

[α]D=-16.1° (CHCl₃,c=1.05,25.0°C).

m.p.100-102°C

No.1c-2

CDCl₃ 300MHz

1.10-2.05(14H,m),2.23(2H,t,J=7.5Hz),2.53(1H,m),2.91(3H,s),3.35(1H,m),3.62(3H,s),5.02-5.30(2H,m),7.50-7.60(3H,m),7.90-8.08(6H,m).

IR(CHCl₃):3016,2946,2868,1728,1437,1398,1340,1160,1086 /cm.

[α]D=-32.5° (CHCl₃,c=1.00,25.0°C).

No.1c-3

CD3OD 300MHz

1.15-2.05(14H,m),2.13(2H,t,J=7.2Hz),2.47(1H,m),2.91(3H,s),3.27(1H,m),4.90-5.30(2H,m),7.37-7.44(3H,m),7.53-7.61(2H,m),7.71-7.77(2H,m),7.81-7.87(2H,m).

IR(KBr):3412,2999,2951,2871,2217,1560,1399,1243,1159,1137,1103,1084.

$[\alpha]_D = -8.6^\circ$ (CH₃OH,c=1.03,23°C).

No.1d-1

CDCl₃ 300MHz

1.00-2.16(15H,m),2.36(2H,t,J=7.2Hz),3.17(1H,m),3.33(3H,s),5.23-5.43(3H,m),7.51-7.59(3H,m),7.91-8.10(6H,m),9.02(1H,brs).

IR(CHCl₃):3382,3268,3028,2954,2874,1715,1442,1400,1337,1162,1120,1089/cm.

$[\alpha]_D = +40.0^\circ$ (CHCl₃,C=0.53,22°C).

No.1d-2

CDCl₃ 300MHz

1.03-2.30(17H,m),3.03(1H,m),4.03(2H,s),5.26(2H,m),5.84(1H,br),5.25-5.29(1H,d,J=6.6Hz),6.03(1H,br),7.14(2H,d,J=8.1Hz),7.26-7.31(5H,m),7.80(2H,d,J=8.1Hz).

IR(CHCl₃):3376,3002,2946,1669,1595,1492,1454,1406,1318,1154/cm.

$[\alpha]_D = +4.3^\circ$ (CHCl₃,c=1.00,23°C).

No.1d-3

CDCl₃ 300MHz

0.96-2.17(17H,m),2.33(2H,t,J=6.9Hz),3.01(1H,m),4.04(2H,s),5.10(1H,d,J=6.6Hz),5.21-5.26(2H,m),7.14(2H,d,J=8.7Hz),7.16-7.32(5H,m),7.78(2H,d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3260,3020,2946,1711,1596,1492,1457,1407,1318,1154/cm.

$[\alpha]_D = +9.3^\circ$ (CHCl₃,c=1.09,25°C).

No.1d-4

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.14(15H,m),2.34(2H,t,J=7.2Hz),3.09(1H,m),3.30(3H,s),4.04(2H,s),5.19(1H,d,J=7.2Hz),5.22-5.39(2H,m),7.10-7.35(7H,m),7.81(2H,d,J=8.1Hz),9.10(1H,brs).

IR(CHCl₃):3382,3260,3028,2952,2874,2670,1713,1595,1492,1450,1405,1338,1160,1120,1092/cm.

[α]_D=+22.2° (CHCl₃,C=1.07,22°C).

No.1d-5

CDCl₃ 300MHz

1.00-2.10(14H,m),2.30-2.39(3H,m),3.15(1H,m),3.35(3H,s),5.18-5.40(3H,m),7.41(1H,d,t,J=0.9and7.8Hz),7.50-7.69(3H,m),7.88-8.15(2H,m),8.60(1H,d,J=1.5Hz),9.06(1H,s).

IR(CHCl₃):3382,3268,3028,2954,2874,1714,1442,1402,1338,1188,1155,1121,1072/cm.

[α]_D=+15.3° (CHCl₃,C=1.00,22°C).

No.1e-1

CDCl₃ 300MHz

1.19-2.45(19H,m),2.58(1H,m),5.63(1H,d,J=3.0Hz),7.42-7.65(4H,m),7.94-8.03(2H,m),8.49-8.50(1H,m).

IR(CHCl₃):3293,3024,1710,1595,1584,1467,1445,1410,1324,1222,1213,1206,1190,1160/cm.

[α]_D=-41.1° (CHCl₃,C=1.01,23°C).

No.1e-2

CDCl₃ 300MHz

1.10-2.25(19H,m),2.94(1H,m),4.12(3H,s),5.53(1H,d,J=7.2Hz),7.39(1H,m),7.50-7.62(3H,m),7.96(1H,d,J=7.5Hz),8.13(1H,s).

IR(CHCl₃):3367,3025,2955,1711,1634,1600,1584,1468,1454,1440,1415,1342,1317,1222,1189,1157/cm.

[α]_D=+1.2° (CHCl₃,C=1.00,25°C).

No.1f- 1

CDCl₃ 300MHz

1.08-2.47(19H,m),2.56(1H,m),3.52(2H,t,J=6.6Hz),5.59(1H,d,J=2.4Hz),7.40-7.66(4H,m),7.95-8.04(2H,m),8.50(1H,d,J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3624,3383,3295,2950,2877,1705,1595,1584,1468,1445,1405,1347,1337,1324,1224,1190,1160/cm.

[α]_D=-54.1° (CHCl₃,C=1.01,23°C).

No.1f- 2

CDCl₃ 300MHz

1.08-2.24(19H,m),2.94(1H,m),3.53(2H,t,J=6.3Hz),4.13(3H,s),5.47(1H,d,J=6.6Hz),7.36-7.63(4H,m),7.96(1H,d,J=6.3Hz),8.14(1H,s).

IR(CHCl₃):3625,3368,3025,3013,2949,2877,1710,1634,1600,1584,1468,1454,1440,1415,1342,1317,1232,1220,1189,1157/cm.

[α]_D=-5.6° (CHCl₃,C=1.00,25°C).

No.1g- 1

CDCl₃ 200MHz

1.17-2.34(15H,m),3.22(1H,m),5.10-5.16(2H,m),5.45(1H,d,J=7.0Hz),7.35-7.66(4H,m),7.95-8.01(2H,m),8.51(1H,d,J=2.0Hz).

IR(CHCl₃):3383,3275,2959,1707,1595,1584,1468,1445,1425,1319,1269,1248,1190,1149,1123/cm.

[α]_D=+64.3° (CHCl₃,C=1.01,23°C).

No.1g- 2

CDCl₃ 300MHz

1.10-2.15(13H,m),2.36(2H,t,J=7.2Hz),3.21(1H,m),4.09(3H,s),5.10-5.22(2H,m),
5.43(1H,d,J=7.8Hz),7.36-7.62(4H,m),7.96(1H,d,J=7.8Hz),8.12(1H,s).

IR(CHCl₃):3366,2959,1708,1635,1600,1585,1467,1454,1440,1415,1345,1318,1
233,1189,1152/cm.

[α]D=+103.1° (CHCl₃,C=1.01,23°C).

No.1h- 1

CDCl₃ 300MHz

0.90-1.60(17H,m),1.83(1H,m),2.11(1H,m),2.22(2H,t,J=7.2Hz),3.07(1H,m),5.11(
1H,d,J=7.2Hz),7.38-7.47(1H,m),7.50-7.60(1H,m),7.60-7.72(2H,m),7.88-8.12(2
H,m),8.54(1H,d,J=0.9Hz).

IR(CHCl₃):3382,3274,2926,1707,1464,1442,1318,1266,1188,1153,1121,1105,1
071,1019/cm.

[α]D=-2.8° (CHCl₃,C=1.01,23°C).

No.1i- 1

[α]365 +50.9° (CHCl₃,c=1.01,24°C).

No.1i- 2

CDCl₃ 300MHz

0.98-1.70(11H,m),1.80-2.00(5H,m),2.19(1H,m),3.03(1H,m),3.64(2H,t,J=6.6Hz),
4.05(2H,s),4.69(1H,d,J=6.6Hz),5.15(1H,m),5.25(1H,m),7.16(2H,d,J=7.2Hz),7.2
7-7.32(5H,m),7.77(2H,d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3376,3004,2946,2316,1596,1492,1453,1407,1318,1154/cm.

[α]D= +3.5° (CHCl₃,c=1.00,22°C).

mp.80.5-82.0°C

No.1j- 1

$[\alpha]_{436} = -7.5 \pm 0.5^\circ$ (CHCl₃, c=1.05, 22°C).

No.1j- 2

$[\alpha]_D = -9.7 \pm 0.5^\circ$ (CHCl₃, c=1.06, 22°C).

No.1j- 3

$[\alpha]_D = +15.0 \pm 0.5^\circ$ (CH₃OH, c=1.06, 24.5°C).

mp. 101-108°C

No.1j- 4

$[\alpha]_D = -28.0 \pm 0.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.06, 24°C).

mp. 159-161°C

1j- 5

$[\alpha]_D = -12.5 \pm 0.5^\circ$ (CHCl₃, c=1.04, 23°C).

mp. 99-101°C

No.1j- 6

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.03(14H, m), 2.20(1H, m), 2.30(2H, t, J=7.3Hz), 3.00(1H, m) 3.68(3H, s), 4.76(1H, d, J=6.8Hz), 5.13-5.35(2H, m), 7.01-7.08(4H, m), 7.19-7.26(1H, m), 7.37-7.46(2H, m), 7.80-7.84(2H, m).

IR(CHCl₃): 3382, 3280, 3080, 3016, 2952, 2900, 1727, 1582, 1486, 1432, 1322, 1150/cm.

$[\alpha]_D = -31.0^\circ$ (CHCl₃, c=1.05, 26°C).

No.1j- 7

CDCl₃ 300MHz

0.91-2.09(14H,m),2.15(1H,m),2.35(2H,t,J=7.5Hz),3.01(1H,m),5.17(1H,d,J=6.8 Hz),5.21-5.34(2H,m),7.01-7.08(4H,m),7.15-7.27(1H,m),7.37-7.43(2H,m),7.80-7.85(2H,m).

IR(CHCl₃):3474,3386,3270,3024,2958,2900,2675,1711,1584,1488,1420,1323,1298,1150/cm.

[α]_D= -13.4° (CHCl₃,c=1.01,26°C).

No.1j-8

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.14(13H,m),2.30(2H,t,J=7.5Hz),2.36(1H,m),2.84(1H,m),2.91(1J=4.8Hz),3.66(3H,s),5.33-5.52(2H,m),6.82-6.87(1H,m),6.93-7.00(2H,m),7.09-7.15(4H,m),7.28-7.36(2H,m),7.54-7.59(1H,m).

IR(CHCl₃):3350,3010,2950,2880,1728,1603,1582,1489 1461,1438,1360,1160/cm.

[α]_D= +75.1° (CHCl₃,c=1.13,26°C).

No.1j-9

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.03(14H,m),2.20(1H,m),2.29(2H,t,J=7.5Hz),3.06(1H,m),3.68(3H,s),4.98(1H,d,J=7.4Hz),5.14-5.34(2H,m),7.46-7.54(2H,m),7.60-7.68(1H,m),7.75-7.80(2H,m),7.88-7.92(2H,m),7.99-8.03(2H,m).

IR(CHCl₃):3384,3280,3020,2960,2888,1727,1662,1600,1316,1273,1163/cm.

[α]_D= -41.0° (CHCl₃,c=1.17,26°C).

No.1j-10

CDCl₃+CD₃OD 300MHz

0.94-2.08(14H,m),2.21(1H,m),2.34(2H,t,J=6.2Hz),3.04(1H,m),5.21-5.35(2H,m),5.40(1H,m),7.49-7.58(2H,m),7.64-7.68(1H,m),7.79-8.06(6H,m).

IR(CHCl₃):3475,3370,3250,3018,2956,2976,2650,1709,1662,1595,1445,1420,
1395,1317,1274,1163/cm.

$[\alpha]_D = -17.1^\circ$ (CHCl₃, c=1.13, 25°C).

No.1j-11

CDCl₃ 300MHz

1.06-1.98(14H,m), 2.24-2.29(3H,m), 3.13(1H,m), 3.66(3H,s), 5.10-5.24(2H,m), 5.4
0(1H,d, J=6.3Hz), 7.39-7.49(3H,m), 7.59-7.64(3H,m), 7.80-7.83(2H,m), 8.08-8.11(
1H,m).

IR(CHCl₃):3302,3012,2948,2905,1727,1661,1593,1435,1332,1312,1287,1271,1
165/cm.

$[\alpha]_D = +15.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.03, 26°C).

No.1j-12

CDCl₃ 300MHz

1.08-1.98(14H,m), 2.23(1H,m), 2.33(2H,t, J=7.5Hz), 3.16(1H,m), 5.18-5.26(2H,m),
5.39-5.45(1H,m), 7.39-7.49(3H,m), 7.60-7.64(3H,m), 7.80-7.83(2H,m), 8.09-8.12(
1H,m).

IR(CHCl₃):3325,3022,2956,2872,2680,1708,1662,1603,1598,1425,1340,1316,1
288,1271,1165/cm.

$[\alpha]_D = +9.7^\circ$ (CHCl₃, c=0.52, 25°C).

No.1j-13

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.00(14H,m), 2.20(1H,m), 2.27(2H,t, J=6.3Hz), 3.03(1H,m), 3.67(3H,s), 4.99(
1H,d, J=6.6Hz), 5.12-5.31(2H,m), 7.47-7.55(2H,m), 7.60-7.69(2H,m), 7.76-7.81(2
H,m), 7.96-8.05(1H,m), 8.08-8.14(1H,m), 8.27-8.28(1H,m).

IR(CHCl₃):3674,3538,3376,3276,3012,2948,2860,1726,1662,1595,1440,1335,1
317,1297,1274,1166,1150/cm.

[α]D=+10.2° (CHCl₃, c=1.00, 25°C).

No. 1j-14

CDCl₃ 300MHz

0.93-2.08(14H, m), 2.21(1H, m), 2.32(2H, t, J=6.3Hz), 3.00(1H, m), 5.20-5.36(2H, m),
5.38(1H, d, J=6.2Hz), 7.50-7.55(2H, m), 7.63-7.71(2H, m), 7.77-7.81(2H, m), 7.99-8.
04(1H, m), 8.10-8.18(1H, m), 8.32-8.36(1H, m).

IR(CHCl₃): 3674, 3480, 3374, 3258, 3012, 2950, 2875, 2650, 1709, 1662, 1598, 1418, 1
335, 1317, 1274, 1143/cm.

[α]D=+61.0° (CHCl₃, c=1.19, 25°C).

No. 1j-15

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.00(14H, m), 2.19(1H, m), 2.30(2H, t, J=7.3Hz), 3.01(1H, m), 3.67(3H, s), 4.82(
1H, d, J=6.6Hz), 5.14-5.34(2H, m), 7.36-7.39(3H, m), 7.53-7.57(2H, m), 7.62-7.66(2
H, m), 7.83-7.88(2H, m).

IR(CHCl₃): 3376, 3276, 3010, 2948, 2868, 2212, 1727, 1597, 1500, 1437, 1325, 1161/c
m.

[α]D=-7.2° (CHCl₃, c=1.00, 26°C).

No. 1j-16

CDCl₃ 300MHz

0.93-2.03(14H, m), 2.15(1H, m), 2.36(2H, t, J=7.5Hz), 3.05(1H, m), 5.20-5.40(3H, m),
7.36-7.39(3H, m), 7.55-7.66(4H, m), 7.84-7.88(2H, m).

IR(CHCl₃): 3470, 3376, 3260, 3012, 2950, 2868, 2675, 2212, 1708, 1596, 1503, 1416, 1
306, 1288, 1166

CDC13 300MHz

1.00-1.60(9H,m), 1.79-1.89(5H,m), 2.17(1H,bs), 2.23(2H,t,J=7.2Hz), 3.03(1H,m),
5.10-5.23(2H,m), 5.49(1H,d,J=6.6Hz), 7.40(1H,t,J=7.4Hz), 7.53(1H,t,J=7.2Hz), 7.
60-7.68(2H,m), 7.98-8.03(2H,m), 8.55(1H,d,J=1.5Hz).

IR(CHCl₃): 3516, 3384, 3270, 2666, 1708, 1632, 1595, 1584, 1467, 1445, 1425, 1374, 1
345, 1321, 1269, 1248, 1218/cm.

[α]D = -7.8° (CHCl₃, c=1.01, 22°C).

No.1j-18

CDC13 300MHz

0.90-2.03(14H,m), 2.19(1H,m), 2.30(2H,t,J=7.5Hz), 3.00(1H,m), 3.67(3H,s), 4.80(
1H,d,J=6.4Hz), 5.14-5.35(2H,m), 6.99-7.04(2H,m), 7.16-7.22(2H,m), 7.34-7.49(4
H,m), 7.57-7.61(1H,m).

IR(CHCl₃): 3376, 3276, 3012, 2948, 2875, 1727, 1583, 1488, 1471, 1432, 1330, 1311, 1
150/cm.

[α]D = +54.0° (CHCl₃, c=0.99, 25°C).

No.1j-19

CDC13 300MHz

0.91-2.09(14H,m), 2.15(1H,m), 2.34(2H,t,J=7.5Hz), 3.01(1H,m), 5.16(1H,d,J=6.6
Hz), 5.24-5.40(2H,m), 7.01-7.08(2H,m), 7.15-7.25(2H,m), 7.35-7.53(4H,m), 7.59-7.
65(1H,m).

IR(CHCl₃): 3470, 3376, 3260, 3012, 2950, 2875, 2640, 1708, 1583, 1488, 1471, 1430, 1
335, 1305, 1149/cm.

[α]D = -21.0° (CHCl₃, c=1.30, 25°C).

No.1j-20

CDC13 300MHz

1.17(1H,m), 1.26-1.34(2H,m), 1.54-2.24(11H,m), 2.31(2H,t,J=7.4Hz), 2.48(1H,bs).

3.37(1H,m),3.67(3H,s),5.35-5.50(2H,m),7.39-7.68(9H,m).

IR(CHCl₃):3377,1727,1601,1435,1362,1168/cm.

No.1j- 2 1

CDCl₃ 300MHz

1,10-2.25(14H,m),2.36(2H,t,J=7.2Hz),2.47(1H,m),2.89(1H,m),5.35-5.53(2H,m),
5.63(1H,d,J=7.2Hz),7.40-7.71(9H,m).

IR(CHCl₃):3674,3496,3374,3234,3010,2952,2870,2640,1730(sh),1710,1605,14
85,1425,1360,1167/cm.

[α]D=-43.0° (CHCl₃,c=1.01,25°C).

No.1j- 2 2

CDCl₃ 300MHz

0,98-1.95(14H,m),2.25-2,31(3H,m),2.95(1H,m),5.19-5.30(2H,m),5.33(1H,d,J=3.
9Hz),6.58(1H,d,J=7.5Hz),6.80(1H,t,J=7.5Hz),6.99-7.05(1H,m),7.44-7.53(6H,m),
7.60-7.73(9H,m),7.94-7.73(3H,m),8.23-8.26(2H,m),10.66(1H,s).

IR(CHCl₃):3475,3372,3260,3008,2952,2868,2722,1725,1710(sh),1663,1590,15
71,1525,1448,1437,1345,1314,1161,1112/cm.

[α]D=+12.9° (CHCl₃,c=0.12,23°C).

No.1j- 2 3

CDCl₃ 300MHz

0.94~1.94(14H,m),2.23-2.30(3H,m),2.98(1H,m),3.68(3H,s),5.09(1H,d,J=6.2Hz),
5.15-5.28(2H,m),7.14-7.22(1H,m),7.34-7.42(2H,m),7.68-7.73(2H,m),7.89-8.03(
4H,m),8.51(1H,s).

IR(CHCl₃):3372,3275,1724,1673,1599,1438,1320,1161/cm.

[α]D= +17.0 ° (CHCl₃,c=1.38,25°C).

No.1j- 2 4

CDCI₃+CD₃OD 300MHz

0.96-2.05(14H,m), 2.25-2.34(3H,m), 2.92(1H,m), 5.16-5.34(2H,m), 7.14-7.22(1H,m), 7.29-7.42(2H,m), 7.70(2H,d, J=7.6Hz), 7.92-8.05(4H,m).

IR(CHCl₃): 3616, 3426, 3375, 3010, 2950, 2828, 2645, 1708, 1672, 1599, 1439, 1323, 1161/cm.

[α]_D=+21.0° (CH₃OH, c=1.00, 22°C).

No.1j- 2 5

CDCI₃ 300MHz

1.03(1H,m), 1.18-2.01(13H,m), 2.20(1H,bs), 2.27(2H,t, J=7.4Hz), 3.08(1H,m), 3.66(3H,s), 5.11(1H,d, J=6.6Hz), 5.14-5.34(2H,m), 7.54-7.62(3H,m), 8.04-8.32(6H,m).

IR(CHCl₃): 3384, 3278, 1726, 1605, 1484, 1448, 1331, 1161/cm.

No.1j- 2 6

CDCI₃+CD₃OD 300MHz

1.03-2.10(14H,m), 2.22(1H,m), 2.31(2H,t, J=7.5Hz), 2.98(1H,m), 5.23-5.38(2H,m), 7.55-7.66(3H,m), 8.05-8.08(2H,m), 8.14-8.18(2H,m), 8.28-8.31(2H,m).

IR(Nujol): 3260, 2720, 2660, 1711, 1545, 1460, 1317, 1163/cm.

[α]_D=+15.8° (CH₃OH, c=1.01, 22°C).

No.1j- 2 7

[α]_D= +16.7° (CHCl₃, c=1.00, 23°C).

No.1j- 2 8

CDCI₃ 300MHz

1.01(1H,m), 1.14-1.29(2H,m), 1.46-2.19(11H,m), 2.33(2H,t, J=7.2Hz), 2.41(1H,bs), 3.18-3.21(5H,m), 3.68(3H,s), 3.73-3.76(4H,m), 4.37(1H,d, J=7.2Hz), 5.35-5.45(2H,m).

IR(CHCl₃): 3392, 1727, 1435, 1335, 1148/cm.

$[\alpha]_D = +10.7^\circ$ (CHCl₃, c=1.39, 26°C).

No.1j- 2 9

CDCl₃ 300MHz

1.00(1H,m), 1.20-1.29(2H,m), 1.48-2.25(12H,m), 2.37(2H,t, J=7.2Hz), 3.17-3.22(5H,m), 3.74-3.79(4H,m), 4.79(1H,d, J=7.8Hz), 5.34-5.54(2H,m).

IR(CHCl₃): 3470, 3390, 3270, 2675, 1709, 1455, 1420, 1315, 1147/cm.

$[\alpha]_D = +16.8^\circ$ (CHCl₃, c=1.42, 26°C).

No.1k- 1

$[\alpha]_D = -25.4^\circ$ (CHCl₃, c=1.08, 23°C).

No.1k- 2

CDCl₃ 200MHz

1.07-2.28(14H,m), 2.32(2H,t, J=7.4Hz), 2.63(1H,m), 3.63(3H,s), 3.93(1H,m), 5.30-5.52(2H,m), 6.35(1H,d, J=7.0Hz), 7.48-7.60(3H,m), 7.88-8.02(6H,m).

IR(CHCl₃): 3438, 3002, 2946, 2868, 1727, 1652, 1514, 1485, 1363, 1310, 1245, 1154 / cm.

$[\alpha]_D = -80.4^\circ$ (CHCl₃, c=1.01, 24.0°C).

No.1k- 3

CDCl₃ 200MHz

1.10-2.26(14H,m), 2.37(2H,t, J=7.2Hz), 2.60(1H,m), 3.93(1H,m), 5.30-5.50(2H,m), 6.33(1H,d, J=7.5Hz), 7.48-7.58(3H,m), 7.88-7.99(6H,m).

IR(CHCl₃): 3446, 3004, 2952, 2874, 1709, 1652, 1515, 1485, 1305, 1153 /cm.

$[\alpha]_D = -96.4^\circ$ (CHCl₃, c=1.05, 23.0°C).

No.1k- 4

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.17(14H,m),2.38(2H,t,J=7.2Hz),2.52(1H,m),3.81(1H,m),5.33-5.50(2H,m),
6.08(1H,d,J=7.6Hz),7.39-7.53(3H,m),7.57-7.62(6H,m).

IR(CHCl₃):3420,3250,3008,2948,2870,2660,2208,1735(sh),1705,1640,1500/cm

$[\alpha]_D = -21.9 \pm 0.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.02, 22°C).

No.1k-5

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.14(14H,m),2.38(2H,t,J=7.2Hz),2.51(1H,m),3.81(1H,m),5.34-5.46(2H,m),
6.07(1H,d,J=7.6Hz),7.33-7.56(5H,m).

IR(CHCl₃):3422,3250,3010,2950,2876,2664,2558,2210,1735(sh),1705,1645,15
02,1441,1410,1307,1276/cm.

$[\alpha]_D = -63.6 \pm 1.9^\circ$ (CHCl₃, c=0.56, 22°C).

No.1k-6

CDCl₃ 300MHz

1.04-2.24(14H,m),2.36(2H,t,J=7.5Hz),2.58(1H,m),3.88(1H,m),5.30-5.43(2H,m),
6.21(1H,d,J=7.2Hz),7.41-7.49(3H,m),7.73-7.77(2H,m).

IR(CHCl₃):3447,3011,2955,1708,1653,1603,1578,1515,1486,1457,1312,1211,1
164/cm.

$[\alpha]_D = -60.3^\circ$ (CHCl₃, C=1.00, 23°C).

No.1k-7

CDCl₃ 300MHz

1.04-2.22(14H,m),2.36(2H,t,J=7.2Hz),2.57(1H,m),3.87(1H,m),5.30-5.44(2H,m),
6.17(1H,d,J=8.7Hz),6.99-7.40(7H,m),7.73(2H,d,J=7.5Hz).

IR(CHCl₃):3449,3013,2955,1739,1708,1651,1609,1588,1522,1487,1243,1227,1
169/cm.

$[\alpha]_D = -60.2^\circ$ (CHCl₃, C=0.92, 23°C).

No.1k-8

CDCl₃ 300MHz

1.04-2.25(14H,m),2.34(2H,t,J=7.5Hz),2.56(1H,m),3.87(1H,m),5.30-5.44(2H,m),
6.19(1H,d,J=7.5Hz),6.83-6.94(6H,m),7.69(2H,d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3599,3455,3012,2955,1711,1644,1604,1577,1524,1507,1492,1290,1
236,1197,1170/cm.

$[\alpha]_D = -47.7^\circ$ (CHCl₃, C=1.01, 22°C).

No.1k-9

CDCl₃ 300MHz

1.04-2.20(14H,m),2.31(3H,s),2.36(2H,t,J=7.2Hz),2.56(1H,m),3.86(1H,m),5.30-
5.43(2H,m),6.16(1H,d,J=7.2Hz),7.00-7.11(6H,m),7.74(2H,d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3450,3010,2955,1750,1709,1651,1609,1596,1523,1489,1370,1247,1
227,1183/cm.

$[\alpha]_D = -54.7^\circ$ (CHCl₃, C=1.01, 22°C).

No.1k-10

CDCl₃ 300MHz

1.04-2.22(14H,m),2.35(2H,t,J=7.2Hz),2.56(1H,m),3.82(3H,s),3.86(1H,m),5.30-
5.43(2H,m),6.17(1H,d,J=6.9Hz),6.89-7.01(6H,m),7.70(2H,d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3023,2955,1742,1708,1649,1613,1602,1577,1522,1507,1490,1227,1
210,1170/cm.

$[\alpha]_D = -58.1^\circ$ (CHCl₃, C=1.01, 22°C).

No.1m-1

CDCl₃ 300MHz

1.06-2.25(14H,m),2.32(2H,t,J=7.4Hz),2.61(1H,m),3.63(3H,s),3.91(1H,m),5.33-
5.47(2H,m),6.24(1H,d,J=6.9Hz),7.35-7.38(3H,m),7.53-7.60(4H,m),7.75-7.78(2

H,m).

IR(CHCl₃):3438,3008,2946,2875,2212,1732,1650,1605,1519,1496/cm.

[α]D= +76° (CHCl₃,c=1.39,24°C)

No.1m-2

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.20(14H,m),2.36(2H,t,J=6.2Hz),2.59(1H,m),3.89(1H,m),5.29-5.48(2H,m),
6.26(1H,d,J=7.0Hz),7.26-7.38(3H,m),7.52-7.60(4H,m),7.73-7.77(2H,m).

IR(CHCl₃):3444,3012,2952,2874,2664,2214,1718(sh),1708,1649,1605,1520,1498/cm.

[α]D= +81.4° (CHCl₃,c=1.01,23°C)

No.1m-3

CDCl₃ 300MHz

1.06-2.23(14H,m),2.32(2H,t,J=7.0Hz),2.62(1H,m),3.63(3H,s),3.93(1H,m),5.30-5.50(2H,m),6.28(1H,d,J=7.0Hz),7.38-7.51(3H,m),7.58-7.67(4H,m),7.83-7.88(2H,m).

IR(CHCl₃):3438,3008,2948,2875,1783(w),1727,1650,1608,1580(w),1523,1501,1482/cm.

[α]D= +59° (CHCl₃,c=1.49,25°C)

No.1m-4

CDCl₃ 300MHz

1.08-2.25(14H,m),2.36(2H,t,J=7.4Hz),2.59(1H,m),3.91(1H,m),5.28-5.48(3H,m),
6.29(1H,d,J=7.4Hz),7.38-7.50(3H,m),7.61-7.67(4H,m),7.81-7.86(2H,m).

IR(CHCl₃):3436,3010,2948,2868,1727,1715(sh),1649,1615(w),1524,1502,1482,1372/cm.

[α]D= +72° (CHCl₃,c=0.98,25°C)

No.1m-5

CDCl₃ 300MHz

1.09-2.20(14H,m),2.32(2H,t,J=7.2Hz),2.63(1H,m),3.63(3H,s),3.92(1H,m),5.31-5.51(2H,m),6.35(1H,d,J=7.0Hz),7.51-7.60(3H,m),7.92-7.97(6H,m).

IR(CHCl₃):3436,3008,2946,2875,1727,1652,1608(w),1515,1484/cm.

[α]_D= +82° (CHCl₃,c=0.99,25°C)

No.1m-6

CDCl₃ 300MHz

1.09-2.23(14H,m),2.37(2H,t,J=7.2Hz),2.60(1H,m),3.92(1H,m),5.30-5.49(2H,m),6.32(1H,d,J=7.4Hz),7.51-7.55(3H,m),7.85-7.98(6H,m).

IR(CHCl₃):3436,3010,2950,2875,2670,1727,1715(sh),1650,1605(w),1515,1484/cm.

[α]_D= +84° (CHCl₃,c=1.54,25°C)

No.1m-7

CDCl₃ 300MHz

1.03-2.18(14H,m),2.32(2H,t,J=7.4Hz),2.59(1H,m),3.64(3H,s),3.89(1H,m),5.29-5.49(2H,m),6.16(1H,d,J=7.8Hz),6.98-7.06(4H,m),7.14-7.20(1H,m),7.34-7.41(2H,m),7.73-7.78(2H,m).

IR(CHCl₃):3438,3008,2946,2868,1727,1648,1610,1586,1519,1485/cm.

[α]_D= +54° (CHCl₃,c=1.29,25°C).

No.1m-8

CDCl₃ 300MHz

1.06-2.21(14H,m),2.36(2H,t,J=7.5Hz),2.58(1H,m),3.88(1H,m),5.31-5.46(2H,m),6.17(1H,d,J=6.9Hz),6.99-7.05(4H,m),7.15-7.21(1H,m),7.36-7.41(2H,m),7.72-7.75(2H,m).

IR(CHCl₃):3436,3010,2948,2868,2675,1730(sh),1709,1647,1608,1586,1520,14

85/cm.

$[\alpha]_D = +56^\circ$ (CHCl₃, c=0.97, 25°C)

No.1m-9

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.18(14H,m), 2.29-2.34(5H,m), 2.59(1H,m), 3.64(3H,s), 3.89(1H,m), 5.32-5.4
6(2H,m), 6.16(1H,d, J=7.5Hz), 7.00-7.11(6H,m), 7.74-7.77(2H,m).

IR(CHCl₃): 3440, 3010, 2946, 2868, 1729, 1649, 1595, 1519, 1488/cm.

$[\alpha]_D = +47^\circ$ (CHCl₃, c=0.82, 25°C).

No.1m-10

CDCl₃ 300MHz

1.04-2.20(14H,m), 2.31-2.39(5H,m), 2.57(1H,m), 3.87(1H,m), 5.28-5.47(2H,m), 6.1
7(1H,d, J=7.0Hz), 6.99-7.12(6H,m), 7.72-7.76(2H,m).

IR(CHCl₃): 3674, 3572, 3438, 3010, 2948, 2868, 2626, 1748, 1710, 1648, 1615, 1595, 1
520, 1489/cm.

$[\alpha]_D = +51^\circ$ (CHCl₃, c=0.91, 25°C)

No.1m-11

CDCl₃ 300MHz

1.04-2.16(14H,m), 2.31(2H,t, J=7.2Hz), 2.59(1H,m), 3.63(3H,s), 3.89(1H,m), 5.29-
5.49(2H,m), 6.24(1H,d, J=7.4Hz), 6.54(1H,s), 6.83-6.93(6H,m), 7.69-7.73(2H,m).

IR(CHCl₃): 3674, 3588, 3438, 3296, 3010, 2946, 2868, 1725, 1646, 1603, 1520, 1504, 1
489/cm.

$[\alpha]_D = +51^\circ$ (CHCl₃, c=0.91, 25°C)

No.1m-12

CDCl₃ 300MHz

1.04-2.21(14H,m), 2.33(2H,t, J=8.0Hz), 2.56(1H,m), 3.87(1H,m), 5.28-5.48(2H,m),

6.23(1H,d,J=8.0Hz),6.75(1H,m),6.87-6.94(6H,m),7.66-7.71(2H,m),9.63(1H,bs).

IR(CHCl₃):3674,3582,3436,3275,3010,2950,2868,2675,1727,1710(sh),1643,1603,1522,1504,1490/cm.

$[\alpha]_D = +30^\circ$ (CHCl₃, c=0.97, 25°C)

No.1m-13

CDCl₃ 300MHz

1.01-2.18(14H,m),2.31(2H,t,J=7.4Hz),2.58(1H,m),3.63(3H,s),3.82(3H,s),3.89(1H,m),5.29-5.48(2H,m),6.14(1H,d,J=7.0Hz),6.88-7.02(6H,m),7.70-7.74(2H,m).

IR(CHCl₃):3442,3402,3004,2946,2868,1727,1648,1600,1518,1499/cm.

$[\alpha]_D = +42^\circ$ (CHCl₃, c=1.82, 26°C)

No.1m-14

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.21(14H,m),2.35(2H,t,J=7.2Hz),2.55(1H,m),3.82(3H,s),3.88(1H,m),5.27-5.46(2H,m),6.16(1H,d,J=7.2Hz),6.88-7.02(6H,m),7.68-7.73(2H,m).

IR(CHCl₃):3438,3012,2948,2870,2650,1730(sh),1709,1647,1615(sh),1601,1519,1492/cm.

$[\alpha]_D = +64^\circ$ (CHCl₃, c=0.70, 25°C)

No.1m-15

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.20(14H,m),2.29-2.36(5H,m),2.62(1H,m),3.63(3H,s),3.92(1H,m),5.30-5.5

0(2H,m),6.25(1H,d,J=7.2Hz),7.16-7.21(2H,m),7.52-7.64(4H,m),7.82-7.87(2H,m).

No.1m-16

CDCl₃ 300MHz

1.08-2.21(14H,m), 2.34-2.40(5H,m), 2.59(1H,m), 3.90(1H,m), 5.29-5.48(2H,m), 6.29(1H,d,J=7.0Hz), 7.18(2H,d,J=8.6Hz), 7.58-7.64(4H,m), 7.83(2H,d,J=8.2Hz).

IR(CHCl₃): 3438, 3012, 2948, 2870, 2622, 1749, 1710, 1649, 1610, 1526, 1508, 1487/cm.

[α]_D=+66° (CHCl₃, c=1.21, 24°C)

No.1m-17

CDCl₃ 300MHz

1.06-2.19(14H,m), 2.32(2H,t,J=7.2Hz), 2.62(1H,m), 3.63(3H,s), 3.93(1H,m), 5.30-5.50(2H,m), 6.32(1H,d,J=7.6Hz), 6.41(1H,s), 6.94(2H,d,J=9.0Hz), 7.47(2H,d,J=9.0Hz), 7.58(2H,d,J=8.6Hz), 7.81(2H,d,J=8.6Hz).

IR(CHCl₃): 3580, 3434, 3284, 3010, 2946, 2868, 1726, 1646, 1606, 1528, 1490/cm.

[α]_D=+62.4° (CHCl₃, c=1.01, 23°C)

No.1m-18

CDCl₃+CD₃OD 300MHz

1.11-2.18(14H,m), 2.32(2H,t,J=7.4Hz), 2.59(1H,m), 3.88(1H,m), 5.30-5.49(2H,m), 6.55(1H,d,J=7.0Hz), 6.92(2H,d,J=8.6Hz), 7.47(2H,d,J=8.6Hz), 7.59(2H,d,J=8.6Hz), 7.79(2H,d,J=8.2Hz).

IR(Nujol): 3398, 3175, 2725, 1696, 1635, 1601, 1531, 1510/cm.

[α]_D=+99.5° (CH₃OH, c=1.011, 25°C)

No.1m-19

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.20(14H,m), 2.32(2H,t,J=7.4Hz), 2.61(1H,m), 3.63(3H,s), 3.86(3H,s), 3.94(1H,m), 5.30-5.50(2H,m), 6.24(1H,d,J=7.0Hz), 6.99(2H,d,J=8.6Hz), 7.53-7.63(4H,m), 7.82(2H,d,J=8.6Hz).

IR(CHCl₃):3440,3006,2946,2875,1726,1649,1606,1527,1510,1489/cm.

[α]_D=+68° (CHCl₃,c=0.88,26°C)

No.1m-20

CDCl₃ 300MHz

1.09-2.20(14H,m),2.35(2H,t,J=7.3Hz),2.58(1H,m),3.85(3H,s),3.89(1H,m),5.28-5.48(2H,m),6.35(1H,d,J=7.2Hz),6.98(2H,d,J=8.8Hz),7.51-7.61(4H,m),7.81(2H,d,J=8.4Hz),8.34(1H,bs).

IR(CHCl₃):3446,3012,2952,2881,2640,1730(sh),1707,1647,1606,1527,1510,1489/cm.

[α]_D=+83° (CHCl₃,c=1.00,25°C).

No.1m-21

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.14(14H,m),2.37(2H,t,J=7.2Hz),2.51(1H,m),3.81(1H,m),5.34-5.46(2H,m),6.11(1H,d,J=7.5Hz),7.33-7.48(3H,m),7.53-7.55(2H,m).

IR(CHCl₃):3420,3250,3008,2948,2870,2660,2210,1735(sh),1705,1645,1503,1441,1409/cm.

[α]_D=+59.2±1.0° (CHCl₃,c=1.023,22°C).

No.1m-22

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.17(14H,m),2.37(2H,t,J=7.2Hz),2.52(1H,m),3.82(1H,m),5.32-5.47(2H,m),6.20(1H,d,J=7.6Hz),7.38-7.53(3H,m),7.58-7.61(6H,m),9.11(1H,bs).

IR(CHCl₃):3420,3250,3010,2984,2870,2675,2208,1730(sh),1705,1640,1500,1406/cm.

[α]_D=+57.4° (CHCl₃,c=1.83,23°C).

No.1m-23

CDC13 300MHz

1.05-2.18(14H,m),2.31(2H,t,J=7.5Hz),2.60(1H,m),3.63(3H,s),3.90(1H,m),5.32-5.47(2H,m),6.22(1H,d,J=6.9Hz),7.40-7.49(3H,m),7.76-7.79(2H,m).

IR(CHCl₃):3438,3008,2946,2868,1727,1651,1603,1585,1512,1484/cm.

[α]_D=+52° (CHCl₃,c=1.49,25°C).

No.1m- 2 4

CDC13 300MHz

1.05-2.21(14H,m),2.36(2H,t,J=7.2Hz),2.57(1H,m),3.89(1H,m),5.28-5.47(2H,m),6.22(1H,d,J=7.0Hz),7.39-7.55(3H,m),7.73-7.79(2H,m).

IR(CHCl₃):3676,3572,3436,3010,2948,2875,1730(sh),1709,1650,1600,1580,1514,1484/cm.

[α]_D=+57° (CHCl₃,c=0.97,26°C).

No.1m- 2 5

CDC13 300MHz

1.04-2.18(14H,m),2.28-2.35(5H,m),2.59(1H,m),3.62(3H,s),3.88(1H,m),5.29-5.49(2H,m),6.20(1H,d,J=7.2Hz),7.15(2H,d,J=9.0Hz),7.80(2H,d,J=8.8Hz).

IR(CHCl₃):3436,3010,2946,2868,1752,1727,1653,1602,1519,1491/cm.

[α]_D=+53° (CHCl₃,c=1.63,25°C).

No.1m- 2 6

CDC13 300MHz

1.05-2.19(14H,m),2.32-2.38(5H,m),2.56(1H,m),3.88(1H,m),5.29-5.47(2H,m),6.25(1H,d,J=7.4Hz),7.15(2H,d,J=9.0Hz),7.78(2H,d,J=8.6Hz).

IR(CHCl₃):3434,3016,3006,2948,2880,2622,1752,1730(sh),1710,1651,1605,1520,1492/cm.

[α]_D=+58° (CHCl₃,c=3.68,24°C)

No.1m- 2 7

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.16(14H,m),2.30(2H,t,J=7.5Hz),2.57(1H,m),3.62(3H,s),3.87(1H,m),5.27-5.47(2H,m),6.32(1H,d,J=7.4Hz),6.85(2H,d,J=8.6Hz),7.62(2H,d,J=8.6Hz),8.35(1H,s).

IR(CHCl₃):3580,3450,3216,3010,2946,2868,1726,1640,1608,1584,1528,1496/cm.

$[\alpha]_D^{+56.2}$ (CHCl₃,c=0.713,23°C)

No.1m- 2 8

CDCl₃ 200MHz

1.10-2.25(14H,m),2.32(2H,t,J=7.2Hz),2.55(1H,bs),3.82-3.93(1H,m),5.27-5.47(2H,m),6.25(1H,d,J=7.4Hz),6.86(2H,d,J=8.6Hz),7.62(2H,d,J=8.6Hz).

IR(CHCl₃):3438,3242,2675,1730(sh),1708,1639,1607,1585/cm.

No.1m- 2 9

CDCl₃ 300MHz

1.05-2.18(14H,m),2.31(2H,t,J=7.4Hz),2.58(1H,m),3.64(3H,s),3.85(3H,s),3.89(1H,m),5.29-5.48(2H,m),6.14(1H,d,J=6.6Hz),6.92(2H,d,J=9.0Hz),7.74(2H,d,J=9.0Hz).

$[\alpha]_D = +62^\circ$ (CHCl_3 , $c = 1.10$, 24°C).

No.1m-31

$\text{CDCl}_3 + \text{CD}_3\text{OD}$ 300MHz

1.16-2.20(14H,m), 2.31(2H,t, $J = 7.2\text{Hz}$), 2.59(1H,m), 3.85(1H,m), 5.31-5.51(2H,m),
7.13-7.21(1H,m), 7.31-7.42(2H,m), 7.68-7.93(6H,m).

IR(Nujol): 3344, 3175, 2715, 2675, 1699, 1631, 1566/ cm^{-1} .

$[\alpha]_D = +67^\circ$ (CH_3OH , $c = 1.01$, 24°C).

No.1m-32

CDCl_3 200MHz

1.09-2.23(14H,m), 2.33(2H,t, $J = 7.1\text{Hz}$), 2.57(1H,bs), 3.40-3.93(9H,m), 4.41(1H,bs),
5.29-5.48(2H,m), 6.44(1H,d, $J = 7.4\text{Hz}$), 7.43(2H,d, $J = 8.2\text{Hz}$), 7.80(2H,d, $J = 7.8\text{Hz}$).

IR(CHCl_3): 3434, 3354, 1726, 1720(sh), 1660(sh), 1626/ cm^{-1} .

No.1m-33

CDCl_3 200MHz

1.14-2.25(14H,m), 2.37(2H,t, $J = 7.3\text{Hz}$), 2.64(1H,bs), 3.93-4.01(1H,m), 5.30-5.51(2H,m),
6.47(1H,d, $J = 7.4\text{Hz}$), 7.63-7.74(2H,m), 7.79(2H,s), 7.89-7.93(1H,m), 8.00(1H,dd, $J = 2.3, 1.0\text{Hz}$),
8.30(1H,d, $J = 1.0\text{Hz}$), 8.65-8.73(2H,m).

IR(CHCl_3): 3450, 2675, 1728, 1707, 1649, 1528, 1509/ cm^{-1} .

$[\alpha]_D = +82.8 \pm 1.2^\circ$ (CHCl_3 , $c = 1.01$, 23°C).

No.2a-1

$[\alpha]_D = +69.0^\circ$ (MeOH , $c = 1.01$, 25°C)

No.2a-2

CDCl_3 300MHz

0.99(1H,d, $J = 10.2\text{Hz}$), 1.15 and 1.24(each 3H, each s), 1.50-2.50(14H,m), 4.30(1

H,m), 5.35-5.52(2H,m), 6.32(1H,d,J=8.7Hz), 7.36-7.49(3H,m), 7.58-7.62(2H,m), 7.66 and 7.80(each 2H,each d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃): 3116, 3014, 2925, 2870, 2663, 1708, 1651, 1610, 1524, 1504, 1484, 1472 / cm.

[α]_D = +64.1° (MeOH, c=1.02, 25°C).

No.2a-3

[α]_D = +76.6° (MeOH, c=1.18, 26°C).

No.2a-4

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H,d,J=10.2Hz), 1.15 and 1.25(each 3H,each s), 1.64-2.51(14H,m), 4.31(1H,m), 5.36-5.53(2H,m), 6.33(1H,d,J=8.4z), 7.50-7.56(3H,m), 7.85-7.98(6H,m).

IR(CHCl₃): 3515, 3452, 3014, 2925, 2870, 1740, 1708, 1654, 1517, 1486, 1470 /cm.

[α]_D = +79.5° (MeOH, c=1.18, 22°C).

No.2a-5

CD₃OD 300MHz

0.98(1H,d,J=9.9Hz), 1.18 and 1.25(each 3H,each s), 1.56-1.71(3H,m), 1.98-2.40(11H,m), 4.17(1H,m), 5.41-5.52(2H,m), 7.52-7.61(3H,m), 7.91-8.01(6H,m).

IR(KBr): 3416, 3063, 2983, 2921, 2869, 1704, 1643, 1566, 1518, 1488, 1408 /cm.

[α]_D = +62.0° (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-6

[α]_D = +64.1° (MeOH)

No.2a-8

$[\alpha]_D = +74.0^\circ$ (MeOH, c=1.01, 25°C).

No.2a-9

$[\alpha]_D = +71.0^\circ$ (MeOH, c=1.10, 25°C).

No.2a-10

$[\alpha]_D = +74.7^\circ$ (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-11

$[\alpha]_D = +72.1^\circ$ (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-12

$[\alpha]_D = +53.1^\circ$ (CHCl₃, c=1.01, 26°C).

m.p. 155.0-156.0°C

No.2a-13

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H, d, J=10.2Hz), 1.18 and 1.25(each 3H, each s), 1.63-2.40(14H, m), 4.30(1H, m), 5.46-5.58(2H, m), 6.44(1H, d, J=8.4Hz), 7.49 and 7.77(each 2H, each d, J=8.7Hz), 7.54(1H, s).

IR(CHCl₃): 3689, 3378, 3028, 3014, 2924, 1713, 1652, 1602, 1522, 1496 /cm.

$[\alpha]_D = +78.3^\circ$ (MeOH, c=0.84, 25°C).

m.p. 205.0-206.0°C

No.2a-14

$[\alpha]_D = +72.5^\circ$ (MeOH, c=1.07, 25°C).

No.2a-15

CDC13 300MHz

0.99(1H,d,J=9.9Hz),1.14 and 1.24(each 3H,each s),1.55-2.44(14H,m),4.27(1H,m),5.30-5.50(2H,m),6.29(1H,d,J=9.0Hz),7.11 and 7.20(each 1H,each d,J=16.2Hz),7.29-7.55(5H,m),7.57 and 7.72(each 2H,each d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3453,3083,3022,3013,2925,2870,1708,1650,1607,1560,1522,1496 / cm.

[α]D= +72.3° (MeOH,c=1.00,27°C).

m.p.115.0-117.0°C

No.2a-16

CDC13 300MHz

0.92(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.23(each 3H,each s),1.50-2.48(14H,m),3.62(3H,s),4.29(1H,m),5.30-5.50(2H,m),6.20(1H,d,J=8.7Hz),6.59 and 6.68(each 1H,each d,J=12.3Hz),7.23(5H,s),7.29 and 7.59(each 2H,each d,J=8.1Hz).

IR(CHCl₃):3453,3024,3016,2924,2870,1730,1651,1607,1520,1495 /cm.

[α]D= +56.8° (MeOH,c=1.04,24°C).

No.2a-17

CDC13 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.23(each 3H,each s),1.50-2.38(14H,m),4.26(1H,m),5.30-5.50(2H,m),6.23(1H,d,J=8.4Hz),6.59 and 6.70(each 1H,each d,J=12.3Hz),7.23(5H,s),7.30 and 7.57(each 2H,each d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3452,3081,3019,3014,2925,2870,2665,1708,1650,1607,1521,1495 / cm.

[α]D= +61.6° (MeOH,c=1.00,27°C).

No.2a-18

CDC13 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.23(each 3H,each,s),1.50-2.50(14H,m),3.61(3

H,s), 4.31(1H,m), 5.35-5.51(2H,m), 6.33(1H,d,J=8.4Hz), 7.48-7.64(4H,m), 7.79-7.83(2H,m), 7.91(1H,dt,J=1.5 and 7.8Hz), 8.01(1H,dt,J=1.5 and 7.8Hz), 8.13(1H,t,J=1.5Hz).

IR(CHCl₃): 3450, 3026, 3013, 2925, 2870, 1730, 1659, 1600, 1510 /cm.

[α]_D = +56.0° (MeOH, c=1.01, 25°C).

No.2a-19

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=9.9Hz), 1.14 and 1.21(each 3H,each s), 1.53-2.60(14H,m), 4.25(1H,m), 5.35-5.64(2H,m), 7.21(1H,d,J=7.8Hz), 7.49-7.68(4H,m), 7.76-7.84(3H,m), 8.25(1H,m), 8.43(1H,m).

IR(CHCl₃): 3382, 3196, 3025, 3015, 2925, 2870, 1725, 1652, 1599, 1577, 1521 /cm.

[α]_D = +55.9° (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-20

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H,d,J=10.2Hz), 1.13 and 1.24(each 3H,each s), 1.50-2.50(14H,m), 3.62(3H,s), 4.31(1H,m), 5.35-5.51(2H,m), 6.24(1H,d,J=8.4Hz), 7.40-7.52(3H,m), 7.71-7.76(2H,m).

IR(CHCl₃): 3453, 3025, 3013, 2925, 2870, 1730, 1753, 1579, 1514, 1486 /cm.

[α]_D = +61.2° (MeOH, c=1.04, 25°C).

No.2a-21

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H,d,J=10.2Hz), 1.13 and 1.23(each 3H,each s), 1.52-2.50(14H,m), 4.28(1H,m), 5.34-5.51(2H,m), 6.27(1H,d,J=8.7Hz), 7.41-7.53(3H,m), 7.71-7.74(2H,m).

IR(CHCl₃): 3452, 3063, 3027, 3014, 2925, 2871, 1708, 1652, 1578, 1515, 1486 /cm.

[α]_D = +62.0° (MeOH, c=1.01, 27°C).

No.2a-22

d6-DMSO 300MHz

0.86(1H,d,J=9.9Hz), 1.10 and 1.16(each 3H,each s), 1.42-1.52(3H,m), 1.85-2.46(11H,m), 3.98(1H,m), 5.32-5.43(2H,m), 7.41(3H,m), 7.88(2H,d,J=6.6Hz), 8.19(1H,d,J=6.6Hz).

IR(KBr):3367,3060,2984,2922,2868,1634,1563,1529,1487/cm.

$[\alpha]_D^{25} = +47.7^\circ$ (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-23

$[\alpha]_D^{27} = +62.7^\circ$ (MeOH, c=1.01, 27°C).

No.2a-24

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H,d,J=10.2Hz), 1.14 and 1.25(each 3H,each s), 1.52-2.50(14H,m), 4.31(1H,m), 5.36-5.52(2H,m), 6.34(1H,d,J=8.4Hz), 7.47-7.52(2H,m), 7.59-7.64(1H,m), 7.78-7.83(6H,m).

IR(CHCl₃):3449,3027,3013,2925,2869,1708,1656,1599,1518,1493 /cm.

$[\alpha]_D^{25} = +63.1^\circ$ (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-25

$[\alpha]_D^{25} = +35.1^\circ$ (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-26

$[\alpha]_D^{25} = +35.5^\circ$ (MeOH, c=1.02, 25°C).

No.2a-27

each d, J=8.7Hz,), 6.98-7.05(2H, m), 7.16(1H, t, J=7.5Hz), 7.34-7.41(2H, m).

IR(CHCl₃): 3455, 3024, 3016, 2924, 2870, 1730, 1651, 1588, 1520, 1487 /cm.

[α]D=+56.4° (MeOH, c=1.01, 25°C).

No.2a-28

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H, d, J=10.2Hz), 1.12 and 1.23(each 3H, each s), 1.52-2.50(14H, m), 4.26(1H, m), 5.34-5.51(2H, m), 6.20(1H, d, J=9.0Hz), 7.01 and 7.70(each 2H, each d, J=9.0Hz,), 6.98-7.15(2H, m), 7.17(1H, t, J=7.5Hz), 7.34-7.40(2H, m).

IR(CHCl₃): 3454, 3031, 3018, 2925, 2870, 1708, 1650, 1588, 1523, 1487/cm.

[α]D= +56.2° (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-29

[α]D=+53.0° (MeOH, c=1.03, 25°C).

No.2a-30

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H, d, J=10.2Hz), 1.10 and 1.23(each 3H, each s), 1.52-2.50(14H, m), 4.25(1H, m), 5.30-5.50(2H, m), 6.23(1H, d, J=8.7Hz), 6.36(1H, s), 7.26-7.39(10H, m), 7.60 and 7.68(each 2H, each d, J=8.4Hz,).

IR(CHCl₃): 3451, 3088, 3064, 3029, 3014, 2925, 2869, 1707, 1652, 1522, 1495 /cm.

[α]D=+54.2° (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-31

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H, d, J=10.2Hz), 1.14 and 1.24(each 3H, each s), 1.50-2.50(14H, m), 3.63(3H, s), 4.31(1H, m), 5.30-5.50(2H, m), 6.26(1H, d, J=8.4Hz), 6.90(1H, t, J=7.4Hz), 7.13(1H, d, J=8.7Hz), 7.29(2H, t, J=8.0Hz), 7.67-7.75(5H, m), 7.82(1H, s).

IR(Nujol): 3380, 3244, 1723, 1638, 1601, 1578, 1535, 1495 /cm.

$[\alpha]_D^{25} = +73.6^\circ$ (MeOH, $c=0.50$, 26°C).

m.p. $133.0-134.0^\circ\text{C}$

No.2a-32

$[\alpha]_D^{25} = +56.1^\circ$ (MeOH, $c=1.02$, 26°C).

No.2a-33

CDCl_3 300MHz

0.95(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.10 and 1.21(each, 3H, each s), 1.50-2.50(14H, m), 4.25(1H, m), 5.13(2H, s), 5.30-5.70(3H, m), 6.41(1H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 6.89(1H, s), 7.09(1H, s), 7.17 and 7.72(each 2H, each d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.62(1H, s).

IR(CHCl_3): 3450, 3125, 3031, 3013, 2925, 2870, 2467, 1917, 1708, 1654, 1615, 1575, 1523, 1497 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +55.2^\circ$ (MeOH, $c=1.01$, 26°C).

No.2a-34

$[\alpha]_D^{25} = +72.9^\circ$ (MeOH, $c=1.03$, 25°C).

No.2a-35

CDCl_3 300MHz

0.98(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.13 and 1.24(each 3H, each s), 1.52-2.48(14H, m), 4.28(1H, m), 5.35-5.51(2H, m), 6.28(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.34-7.37(3H, m), 7.52-7.55(2H, m), 7.58 and 7.71(each 2H, each d, $J=8.7\text{Hz}$).

IR(CHCl_3): 3515, 3452, 3030, 3012, 2925, 2870, 1739, 1708, 1652, 1607, 1555, 1521, 1497 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +74.3^\circ$ (MeOH, $c=1.01$, 25°C).

No.2a-36

$[\alpha]_D^{25} = +23.4^\circ$ (MeOH, $c=1.07$, 25°C)

No.2a-37

CDCl₃ 300MHz

0.83(1H,d,J=10.5Hz),0.95 and 1.18(each 3H,each s),1.44-2.46(14H,m),3.92(1H,m),5.34-5.52(3H,m),7.26-7.54(9H,m),7.62(1H,s).

IR(CHCl₃):3432,3310,3189,3023,3014,2924,2870,1704,1610,1594,1523,1487 / cm.

[α]D=+25.3° (MeOH,c=1.00,26°C).

No.2a-38

[α]D=+70.9° (MeOH,c=1.02,25°C).

No.2a-39

[α]D=+70.6° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-40

[α]D=+74.7° (MeOH,c=1.00,25°C).

No.2a-41

[α]D=+72.1° (MeOH,c=1.01,24°C).

No.2a-42

[α]D=+69.2° (MeOH,c=1.00,25°C).

No.2a-43

[α]D=+70.8° (MeOH,c=1.00,25°C).

No.2a-44

[α]D=+60.4° (MeOH,c=1.00,26°C).

No.2a-45

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d,J=9.9Hz),1.13 and 1.23(each 3H,each s),1.55-2.52(14H,m),4.29(1H,m),5.34-5.54(2H,m),6.33(1H,d,J=9.0Hz),7.10(1H,t,J=7.4Hz),7.34(2H,t,J=7.4Hz),7.52(2H,m),7.68 and 7.75(each 2H,each d,J=8.4Hz),7.80(1H,s),8.10(1H,s),10.09(1H,s).

IR(CHCl₃):3393,3195,3093,3033,3013,2925,2870,1698,1656,1598,1537,1498 / cm.

[α]D=+59.4° (MeOH,c=1.01,24°C).

No.2a-46

[α]D=+63.5° (MeOH,c=1.00,25°C).

No.2a-47

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d,J=9.9Hz),1.12 and 1.23(each 3H,each s),1.54-2.48(14H,m),4.29(1H,m),5.35-5.52(2H,m),6.32(1H,d,J=8.7Hz),7.26(1H,m),7.41(2H,t,J=7.8Hz),7.64(2H,d,J=7.5Hz),7.73 and 7.77(each 2H,each d,J=8.4Hz),7.95(1H,s),9.20(1H,s),10.38(1H,s).

IR(CHCl₃):3450,3339,3003,2992,2925,2870,1706,1653,1596,1523,1495/cm.

[α]D=+63.3° (MeOH,c=1.00,25°C).

No.2a-48

[α]D=+63.8° (MeOH,c=1.00,24°C).

No.2a-49

CDCl₃ 300MHz

1.00(1H,d,J=10.5Hz),1.17 and 1.26(each 3H,each s),1.55-2.52(14H,m),4.34(1

H,m), 5.36-5.54(2H,m), 6.35(1H,d,J=9.0Hz), 7.50-7.62(3H,m), 7.90 and 8.33(eac
h 2H,each d,J=8.4Hz), 8.21(2H,m).

IR(CHCl₃): 3451, 3029, 3022, 3016, 2925, 2870, 1708, 1655, 1542, 1508, 1498, 1471, 1
459 /cm.

[α]D=+63.5° (MeOH,c=1.02,25°C).

m.p. 135.0-137.0°C

No.2a-50

[α]D=+68.9° (MeOH,c=1.01,24°C).

No.2a-51

d₆-DMSO 300MHz

0.87(1H,d,J=9.9Hz), 1.10 and 1.17(each 3H,each s), 1.40-1.60(3H,m), 1.90-2.4
0(11H,m), 3.98(1H,m), 5.35-5.46(2H,m), 7.64(1H,s), 7.65 and 7.91(each 2H,eac
h d,J=8.7Hz), 8.06(1H,d,J=6.0Hz), 9.32(1H,bs).

IR(KBr): 3385, 2962, 1734, 1707, 1632, 1529, 1498 /cm.

[α]D=+68.4° (MeOH,c=1.01,24°C).

No.2a-52

[α]D=+76.2° (MeOH,c=1.01,24°C).

No.2a-53

[α]D=+73.9° (MeOH,c=1.02,24°C).

No.2a-54

[α]D=+68.1° (MeOH,c=1.00,24°C).

No.2a-55

[α]D=+67.8° (M OH,c=1.00,24°C).

No.2a-56

$[\alpha]_D^{25} = +65.4^\circ$ (MeOH, c=1.03, 25°C).

No.2a-57

$[\alpha]_D^{24} = +63.4^\circ$ (MeOH, c=1.01, 24°C).

No.2a-58

$[\alpha]_D^{24} = +66.6^\circ$ (MeOH, c=1.01, 24°C).

No.2a-59

$[\alpha]_D^{24} = +65.5^\circ$ (MeOH, c=1.00, 24°C).

No.2a-60

$[\alpha]_D^{25} = +60.9^\circ$ (MeOH, c=1.02, 25°C).

No.2a-61

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H, d, J=10.0Hz), 1.10 and 1.22(each 3H, each s), 1.50-2.50(14H, m), 4.26(1H, m), 5.30-5.54(2H, m), 6.28(1H, d, J=8.6Hz), 6.60 and 6.82(each 1H, each d, J=12.4Hz), 7.12(2H, d, J=6.0Hz), 7.25 and 7.62(each 2H, each d, J=8.6Hz), 8.47(2H, d, J=6.0Hz).

IR(CHCl₃): 3452, 3027, 3019, 3013, 2925, 2870, 2480, 1708, 1651, 1606, 1520, 1494 / cm.

$[\alpha]_D^{25} = +61.6^\circ$ (MeOH, c=1.01, 25°C).

No.2a-62

$[\alpha]_D^{25} = +72.0^\circ$ (MeOH, c=0.93, 25°C).

No.2a-63

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H,d,J=10.2Hz),1.14 and 1.24(each 3H,each s),1.50-2.50(14H,m),4.29(1H,m),5.36-5.55(2H,m),6.35(1H,d,J=9.1Hz),7.04 and 7.27(each 1H,each d,J=16.5Hz),7.37(2H,d,J=6.6Hz),7.56 and 7.76(each 2H,each d,J=8.4Hz),8.57(2H,d,J=6.6Hz).

IR(CHCl₃):3452,3024,3018,3014,2925,2870,2470,1933,1708,1652,1605,1521,1496 /cm.

[α]D=+69.2° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-64

[α]D=+56.9° (MeOH,c=1.24,25°C).

No.2a-65

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H,d,J=10.5Hz),1.12 and 1.23(each 3H,each s),1.54-2.46(14H,m),4.27(1H,m),5.23(2H,s),5.34-5.52(2H,m),6.26(1H,d,J=8.4Hz),7.32-7.45(5H,m),7.64 and 7.71(each 2H,each d,J=8.4Hz),8.15(1H,s).

IR(CHCl₃):3452,3088,3065,3032,3013,2925,2870,1708,1653,1611,1559,1522,1496 /cm.

[α]D=+61.0° (MeOH,c=0.91,25°C).

No.2a-66

[α]D=+76.0° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-67

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H,d,J=10.4Hz),1.14 and 1.24(each 3H,each s),1.54-2.46(14H,m),4.28(1H,m),5.32-5.53(2H,m),6.27(1H,d,J=8.6Hz),6.92-7.31(each 1H,each d,J=16.4Hz)

z), 7.02(1H, dd, J=5.8 and 3.6 Hz), 7.12(1H, d, J=3.6 Hz), 7.24(1H, d, J=5.8 Hz), 7.51 and 7.70(each 2H, each d, J=8.4 Hz).

IR(CHCl₃): 3453, 3029, 3013, 2925, 2870, 1739, 1650, 1604, 1524, 1515, 1494 /cm.

[α]_D=+76.2° (MeOH, c=1.00, 24°C).

m.p. 104.0-106.0°C

No. 2a-68

[α]_D=+57.7° (MeOH, c=1.01, 25°C).

No. 2a-69

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H, d, J=10.2 Hz), 1.14 and 1.24(each 3H, each s), 1.54-2.48(14H, m), 4.28(1H, m), 5.34-5.53(2H, m), 6.29(1H, d, J=9.0 Hz), 6.54-6.74(each 1H, each d, J=12.0 Hz), 7.02(1H, dd, J=4.8 and 3.3 Hz), 6.97(1H, dd, J=3.3 and 1.2 Hz), 7.13(1H, dd, J=4.8 and 1.2 Hz), 7.44 and 7.70(each 2H, each d, J=8.7 Hz).

IR(CHCl₃): 3453, 3025, 3010, 2925, 2870, 1708, 1650, 1607, 1559, 1523, 1493 /cm.

[α]_D=+58.4° (MeOH, c=1.00, 25°C).

No. 2a-70

[α]_D=+48.6° (MeOH, c=1.00, 25°C).

No. 2a-71

CDCl₃ 300MHz

No.2a-72

$[\alpha]_D^{+51.2^\circ}$ (M OH, c=1.02, 25°C).

No.2a-73

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H, d, J=9.9Hz), 1.11 and 1.23(each 3H, each s), 1.54-2.48(14H, m), 4.27(1H, m), 5.32-5.52(2H, m), 6.24(1H, d, J=9.0Hz), 6.83-6.94(6H, m), 7.65(2H, d, J=9.0Hz).

IR(CHCl₃): 3598, 3451, 3199, 3033, 3012, 2925, 2870, 1708, 1642, 1604, 1524, 1507, 1491 /cm.

$[\alpha]_D^{+52.2^\circ}$ (MeOH, c=1.01, 25°C).

No.2a-74

$[\alpha]_D^{+51.5^\circ}$ (MeOH, c=0.92, 25°C).

No.2a-75

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H, d, J=10.2Hz), 1.11 and 1.23(each 3H, each s), 1.55-2.46(14H, m), 3.82(3H, s), 4.25(1H, m), 5.32-5.52(2H, m), 6.19(1H, d, J=8.7Hz), 6.89-7.01(6H, m), 7.65-7.68(2H, m).

IR(CHCl₃): 3450, 3025, 3008, 2925, 2870, 2837, 1741, 1649, 1612, 1521, 1505, 1490 /cm.

$[\alpha]_D^{+51.1^\circ}$ (MeOH, c=1.00, 25°C).

No.2a-76

$[\alpha]_D^{+60.4^\circ}$ (MeOH, c=0.98, 25°C).

No.2a-77

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H,d,J=10.5Hz),1.15 and 1.24(each 3H,each s),1.54-2.48(14H,m),2.34(3H,s),4.29(1H,m),5.32-5.54(2H,m),6.32(1H,d,J=8.4Hz),7.19 and 7.60(each 2H,each d,J=8.4Hz),7.63 and 7.79(each 2H,each d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3452,3027,3012,2925,2870,1751,1709,1651,1611,1560,1527,1509,1489 /cm.

[α]D=+61.2° (MeOH,c=1.00,25°C).

No.2a-78

[α]D=+67.4° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-79

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H,d,J=10.2Hz),1.15 and 1.24(each 3H,each s),1.54-2.54(14H,m),4.31(1H,m),5.32-5.54(2H,m),6.36(1H,d,J=8.2Hz),6.93 and 7.48(each,2H,each d,J=8.6Hz),7.59 and 7.75(each 2H,each d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3593,3448,3192,3030,3010,2925,2870,1708,1644,1608,1591,1559,1530,1516,1491 /cm.

[α]D=+65.8° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-80

[α]D=+66.9° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-81

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H,d,J=10.5Hz),1.15 and 1.24(each 3H,each s),1.54-2.48(14H,m),3.86(3H,s),4.29(1H,m),5.34-5.52(2H,m),6.20(1H,d,J=8.7Hz),6.99 and 7.55(each 2H,each d,J=9.0Hz),7.61 and 7.77(each 2H,each d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3450,3009,2925,2870,2838,1740,1708,1650,1608,1557,1528,1512,1

491 /cm.

$[\alpha]_D = +66.2^\circ$ (MeOH, c=1.01, 25°C).

No.2a-82

$[\alpha]_D = +57.7^\circ$ (MeOH, c=1.02, 24°C).

No.2a-83

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H, d, J=10.2Hz), 1.12 and 1.23(each 3H, each s), 1.54-2.48(14H, m), 2.33(3H, s), 4.26(1H, m), 5.32-5.52(2H, m), 6.25(1H, d, J=8.7Hz), 7.16 and 7.75(each 2H, each d, J=8.7Hz).

IR(CHCl₃): 3452, 3030, 3022, 3012, 2925, 2870, 1754, 1709, 1654, 1604, 1585, 1522, 1493 /cm.

$[\alpha]_D = +57.4^\circ$ (MeOH, c=1.01, 24°C).

No.2a-84

$[\alpha]_D = +57.8^\circ$ (MeOH, c=1.01, 24°C).

No.2a-85

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H, d, J=10.2Hz), 1.12 and 1.22(each 3H, each s), 1.54-2.48(14H, m), 4.25(1H, m), 5.32-5.52(2H, m), 6.28(1H, d, J=8.7Hz), 6.87 and 7.57(each 2H, each d, J=9.0Hz).

IR(CHCl₃): 3590, 3450, 3166, 3019, 3012, 2925, 2871, 1708, 1637, 1608, 1583, 1531, 1498 /cm.

$[\alpha]_D = +56.0^\circ$ (MeOH, c=1.01, 24°C).

No.2a-86

$[\alpha]_D = +59.3^\circ$ (MeOH, c=1.01, 22°C).

No.2a-87

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H,d,J=10.0Hz), 1.13 and 1.23(each 3H,each s), 1.54-2.48(14H,m), 3.85(3H,s), 4.25(1H,m), 5.32-5.53(2H,m), 6.19(1H,d,J=8.8Hz), 6.93 and 7.69(each 2H, each d,J=9.0Hz).

IR(CHCl₃): 3450, 3030, 3017, 3012, 2925, 2870, 2840, 1740, 1708, 1647, 1606, 1575, 1525, 1496 /cm.

[α]_D=+58.2° (MeOH,c=0.99,22°C).

No.2a-88

[α]_D=+50.9° (MeOH,c=1.02,25°C).

No.2a-89

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H,d,J=10.2Hz), 1.18 and 1.26(each 3H,each s), 1.56-2.48(14H,m), 4.29(1H,m), 5.36-5.54(2H,m), 7.03(1H,d,J=8.7Hz), 7.21(1H,s), 7.43(2H,m), 7.74(1H,ddd, J=1.8,6.9 and 8.7Hz), 8.22(1H,dd,J=1.8 and 8.1Hz).

IR(CHCl₃): 3443, 3087, 3023, 3014, 2925, 2870, 1708, 1685, 1658, 1630, 1517, 1466 /cm.

[α]_D=+57.1° (MeOH,c=1.01,22°C).

m.p. 117.0-118.0°C

No.2a-90

[α]_D=+54.1° (MeOH,c=1.01,22°C).

H,m),5.34-5.52(2H,m),6.49-6.53(2H,m),7.11(1H,dd,J=0.9 and 3.6Hz),7.44(1H,dd,J=0.9 and 1.8Hz).

IR(CHCl₃):3437,3033,3022,3014,2925,2870,1739,1708,1655,1595,1520,1472 / cm.

[α]D=+55.0° (MeOH,c=1.00,22°C).

No.2a-92

[α]D=+50.3° (MeOH,c=1.00,22°C).

No.2a-93

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=10.5Hz),1.12 and 1.23(each 3H,each s),1.52-2.46(14H,m),4.25(1H,m),5.34-5.52(2H,m),6.12(1H,d,J=8.7Hz),7.07(1H,dd,J=3.9 and 5.1Hz),7.45-7.48(2H,m).

IR(CHCl₃):3450,3023,3011,2925,2870,1739,1708,1645,1531,1501,1471 /cm.

[α]D=+49.1° (MeOH,c=1.02,24°C).

No.2a-94

[α]D=+51.5° (MeOH,c=1.00,24°C).

No.2a-95

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.5Hz),1.11 and 1.23(each 3H,each s),1.52-2.46(14H,m),4.25(1H,m),5.34-5.56(2H,m),6.14(1H,d,J=8.7Hz),7.34(2H,d,J=2.0Hz),7.85(1H,t,J=2.0 Hz).

IR(CHCl₃):3452,3114,3030,3013 2925,2870,1708,1649,1535,1498,1471 /cm.

[α]D=+55.5° (MeOH,c=1.00,25°C).

m.p.87.0-88.0°C

No.2a-96

CD3OD 300MHz

0.94(1H,d,J=10.2Hz),1.13 and 1.22(each 3H,each s),1.50-1.76(3H,m),1.94-2.39(11H,m),4.11(1H,m),5.39-5.49(2H,m),7.43-7.51(2H,m),8.05(1H,m).

IR(KBr):3369,3084,2985,2921,2868,1630,1566,1538,1503 /cm.

$[\alpha]_D^{+38.8}$ (MeOH,c=1.01,22°C).

No.2a-97

CD3OD 300MHz

0.93(1H,d,J=9.9Hz),1.13 and 1.22(each 3H,each s),1.48-1.58(3H,m),1.96-2.36(11H,m),4.10(1H,m),5.35-5.50(2H,m),7.42-7.51(2H,m),8.06(1H,m).

IR(KBr):3447,3087,2987,2922,2868,1629,1545,1501 /cm.

$[\alpha]_D^{+52.9}$ (MeOH,c=1.01,24°C).

No.2a-98

$[\alpha]_D^{+53.2}$ (MeOH,c=1.02,23°C).

No.2a-99

CDCl3 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.12 and 1.22(each 3H,each s),1.26-2.45(24H,m),4.25(2H,m),5.34-5.52(2H,m),6.18(1H,d,J=8.7Hz),6.91 and 7.66(each 2H,each d,J=9.0Hz).

IR(CHCl3):3455,3029,3019,2939,2862,1738,1709,1645,1605,1523,1494 /cm.

$[\alpha]_D^{+51.4}$ (MeOH,c=1.00,23°C).

No.2a-100

$[\alpha]_D^{+49.3}$ (MeOH,c=1.00,24°C).

No.2a-101

$[\alpha]_D^{25} = +51.3^\circ$ (MeOH, $c = 1.00$, 24°C).

No.2a-102

$[\alpha]_D^{25} = +48.8^\circ$ (MeOH, $c = 1.01$, 23°C).

No.2a-103

CDCl_3 300MHz

0.94(1H, d, $J = 10.2\text{Hz}$), 1.12 and 1.22(each 3H, each s), 1.52-2.46(14H, m), 2.48(3H, d, $J = 0.3\text{Hz}$), 4.20(1H, m), 5.32-5.54(2H, m), 6.46(1H, bs), 7.12(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$).

IR(CHCl_3): 3415, 3144, 3029, 3011, 2926, 2871, 1708, 1671, 1598, 1538, 1456 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +49.6^\circ$ (MeOH, $c = 1.01$, 23°C).

No.2a-104

$[\alpha]_D^{25} = +77.0^\circ$ (MeOH, $c = 1.02$, 23°C).

No.2a-105

CDCl_3 300MHz

0.93(1H, d, $J = 9.9\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.51-2.44(14H, m), 3.90(6H, s), 4.20(1H, m), 5.38-5.50(2H, m), 5.87(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 6.25 and 7.54(each 1H, each d, $J = 15.6\text{Hz}$), 6.84(1H, d, $J = 8.1\text{Hz}$), 7.03(1H, d, $J = 1.8\text{Hz}$), 7.09(1H, dd, $J = 1.8$ and 8.1Hz).

IR(CHCl_3): 3439, 3028, 3012, 2937, 2871, 2841, 1739, 1708, 1661, 1620, 1600, 1513 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +77.3^\circ$ (MeOH, $c = 1.01$, 23°C).

No.2a-106

$[\alpha]_D^{25} = +67.0^\circ$ (MeOH, $c = 1.00$, 25°C).

No.2a-107

ALL INFORMATION CONTAINED
HEREIN IS UNCLASSIFIED

H,m),5.35-5.50(2H,m),6.22(1H,d,J=8.4Hz),7.40 and 7.66(each 2H,each d,J=9.0Hz).

IR(CHCl₃):3439,3028,3012,2937,2871,2841,1739,1708,1661,1620,1600,1513 / cm.

[α]D=+65.6° (MeOH,c=1.01,22°C).

No.2a-113

[α]D=+59.6° (MeOH,c=1.00,24°C).

No.2a-114

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H,d,J=10.2Hz),1.12 and 1.24(each 3H,each s),1.52-2.46(14H,m),4.29(1H,m),5.35-5.51(2H,m),6.28(1H,d,J=8.4Hz),7.70 and 7.83(each 2H,each d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3439,3028,3012,2937,2871,2841,1739,1708,1661,1620,1600,1513 / cm.

[α]D=+60.6° (MeOH,c=1.01,22°C).

No.2a-115

[α]D=+59.7° (MeOH,c=0.99,24°C).

No.2a-116

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.12 and 1.23(each 3H,each s),1.52-2.46(14H,m),2.39(3H,s),4.27(1H,m),5.33-5.51(2H,m),6.24(1H,d,J=9.0Hz),7.23 and 7.62(each 2H,each d,J=8.4Hz).

IR(CHCl₃):3439,3028,3012,2937,2871,2841,1739,1708,1661,1620,1600,1513/cm.

[α]D=+59.7° (MeOH,c=0.99,24°C).

No.2a-117

$[\alpha]_D^{25} = +56.7^\circ$ (MeOH, $c=1.00$, 23°C).

No.2a-118

CDCl_3 300MHz

0.96(1H,d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.11 and 1.23(each 3H,each s), 1.53-2.44(14H,m), 4.23(1H,m), 5.34-5.51(2H,m), 6.02(2H,s), 6.13(1H,d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.83(1H,dd, $J=1.2$ and 7.8Hz), 7.22-7.25(2H,m).

IR(CHCl_3): 3453, 3031, 3020, 3012, 2924, 2870, 1740, 1708, 1650, 1619, 1605, 1519, 1504, 1480 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +57.2^\circ$ (MeOH, $c=1.02$, 23°C).

No.2a-119

CDCl_3 300MHz

0.96(1H,d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.07 and 1.23(each 3H,each s), 1.51-2.44(14H,m), 2.32(3H,s), 4.26(1H,m), 5.37-5.52(2H,m), 6.40(1H,d, $J=9.0\text{Hz}$), 7.09(1H,m), 7.30(1H,m), 7.46(1H,m), 7.66(1H,m).

IR(CHCl_3): 3443, 3028, 3012, 2925, 2870, 1766, 1747, 1709, 1657, 1607, 1516, 1479 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +53.2^\circ$ (MeOH, $c=0.99$, 21°C).

No.2a-120

CDCl_3 300MHz

0.98(1H,d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.14 and 1.24(each 3H,each s), 1.53-2.44(14H,m), 4.30(1H,m), 5.35-5.52(2H,m), 6.42(1H,d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.85(1H,m), 6.99(1H,dd, $J=1.2$ and 8.4Hz), 7.27(1H,m), 7.39(1H,m).

IR(CHCl_3): 3463, 3033, 3021, 3014, 2992, 2924, 2870, 1708, 1643, 1597, 1523, 1488 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +46.3^\circ$ (MeOH, $c=1.01$, 21°C).

No.2a-121

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H,d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.14 and 1.23(each 3H,each s), 1.47-2.47(14H,m), 3.95(3H,s), 4.31(1H,m), 5.32-5.50(2H,m), 6.98(1H,dd, $J=0.9$ and 8.4Hz), 7.09(1H,ddd, $J=0.9$, 7.7 and 8.4Hz), 7.45(1H,m), 8.19(1H,dd, $J=2.1$ and 8.1Hz), 8.32(1H,d, $J=9.0\text{Hz}$).

IR(CHCl₃): 3400, 3078, 3028, 3020, 3007, 2924, 2870, 2842, 1736, 1708, 1640, 1600, 1536, 1483, 1470 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +38.1^\circ$ (MeOH, $c=1.02$, 23°C).

No.2a-122

$[\alpha]_D^{25} = +42.3^\circ$ (MeOH, $c=0.99$, 23°C).

No.2a-123

$[\alpha]_D^{25} = +38.7^\circ$ (MeOH, $c=1.00$, 21°C).

No.2a-124

$[\alpha]_D^{25} = +45.0^\circ$ (MeOH, $c=1.01$, 21°C).

m.p. $119.0-120.0^\circ\text{C}$

No.2a-125

$[\alpha]_D^{25} = +49.8^\circ$ (MeOH, $c=1.01$, 22°C).

No.2a-126

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.11 and 1.23(each 3H,each s), 1.52-2.47(14H,m), 4.26(1H,m), 5.34-5.50(2H,m), 6.22(1H,d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.55-7.61(4H,m).

IR(CHCl₃):3400,3078,3028,3020,3007,2924,2870,2842,1736,1708,1640,1600,1536,1483,1470 /cm.

$[\alpha]_D^{23} = +63.0^\circ$ (MeOH, c=1.01, 23°C).

No.2a-127

CDCl₃ 300MHz

0.91(1H,d,J=10.2Hz), 1.10 and 1.20(each 3H,each s), 1.50-2.42(14H,m), 4.23(1H,m), 5.31-5.51(2H,m), 6.45(1H,d,J=8.4Hz), 7.01(1H,t,J=7.4Hz), 7.22-7.27(2H,m), 7.33-7.40(4H,m), 7.53(2H,d,J=9.0Hz), 8.30 and 8.48(each 1H,each s).

IR(CHCl₃):3452,3028,3022,3015,2925,2870,1708,1654,1590,1514,1478 /cm.

$[\alpha]_D^{23} = +59.5^\circ$ (MeOH, c=1.01, 23°C).

No.2a-128

d₆-DMSO 300MHz

0.84(1H,d,J=9.9Hz), 1.06 and 1.19(each 3H,each s), 1.37-2.37(14H,m), 3.79(1H,m), 5.35-5.51(2H,m), 6.08(1H,d,J=8.7Hz), 6.85-6.90(1H,m), 7.18-7.23(2H,m), 7.35-7.38(2H,m), 8.42(1H,s), 12.00(1H,s).

IR(Nujol):3395,3345,2925,2866,2623,2506,1697,1658,1638,1597,1557 /cm.

$[\alpha]_D^{23} = +26.0^\circ$ (MeOH, c=1.01, 23°C).

m.p.164.0-166.0°C

No.2a-129

CDCl₃ 300MHz

1.01(1H,d,J=10.0Hz), 1.17 and 1.25(each 3H,each s), 1.54-2.52(14H,m), 4.34(1H,m), 5.36-5.57(2H,m), 6.42(1H,d,J=8.6Hz), 7.51-7.60(2H,m), 7.77(1H,dd,J=1.8 and 8.6Hz), 7.85-7.96(3H,m), 8.24(1H,bs).

IR(CHCl₃):3451,3060,3028,3010,2925,2870,1708,1652,1629,1600,1517,1502 /cm.

$[\alpha]_D^{22} = +68.6^\circ$ (MeOH, c=1.00, 22°C).

No.2a-130

CDCl₃ 300MHz

1.02(1H,d,J=10.2Hz),1.04 and 1.26(each 3H,each s),1.54-2.52(14H,m),4.41(1H,m),5.41-5.58(2H,m),6.14(1H,d,J=9.0Hz),7.43-7.59(4H,m),7.85-7.92(2H,m),8.27(1H,dd,J=1.8 and 7.2Hz).

IR(CHCl₃):3436,3032,3010,2924,2870,2664,1708,1652,1512,1498 /cm.

[α]D=+93.9° (MeOH,c=1.00,22°C)

m.p.94.0-96.0°C

No.2a-131

[α]D=+50.2° (MeOH,c=0.95,21°C).

No.2a-132

[α]D=+10.9° (MeOH,c=0.92,21°C).

No.2a-133

[α]D=+60.4° (MeOH,c=1.00,21°C).

No.2a-134

[α]D=+38.5° (MeOH,c=1.01,23°C).

No.2a-135

[α]D=+52.5° (MeOH,c=1.01,23°C).

m.p.180.0-182.0°C

No.2a-136

[α]D=+35.3° (MeOH,c=1.02,23°C).

m.p.72.0-80.0°C

No.2a-137

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.22(each 3H,each s),1.43(3H,t,J=6.9Hz),1.52-2.44(14H,m),4.03(2H,q,J=6.9Hz),4.26(1H,m),5.33-5.50(2H,m),6.19(1H,d,J=8.7Hz),6.88-7.00(6H,m),7.65-7.68(2H,m).

IR(CHCl₃):3455,3031,3024,3014,2988,2925,2870,1741,1708,1649,1602,1521,1504,1490 /cm.

[α]D=+52.0° (MeOH,c=1.01,23°C).

No.2a-138

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.22(each 3H,each s),1.35(6H,d,J=6.0Hz),1.53-2.46(14H,m),4.25(1H,m),4.51(1H,m),5.33-5.50(2H,m),6.12(1H,d,J=9.0Hz),6.87-6.99(6H,m),7.65-7.68(2H,m).

IR(CHCl₃):3454,3031,3014,2980,2925,2870,1741,1708,1649,1602,1522,1490 /cm.

[α]D=+50.0° (MeOH,c=1.05,22°C).

No.2a-139

CDCl₃ 300MHz

1.00(1H,d,J=10.2Hz),1.16 and 1.24(each 3H,each s),1.59-2.52(14H,m),4.31(1H,m),5.40-5.53(2H,m),6.36(1H,d,J=8.7Hz),6.70(1H,d,J=1.5Hz),7.12(1H,m),7.3

CDC13 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.18 and 1.23(each 3H,each s),1.57-2.50(14H,m),4.35(1H,m),5.32-5.55(2H,m),6.42(1H,d,J=8.7Hz),6.70(1H,d,J=1.5Hz),7.21-7.24(2H,m),7.46(1H,m),7.76(1H,m),7.86(1H,d,J=3.0Hz),10.20(1H,s).

IR(CHCl₃):3465,3010,2924,1739,1604,1546,1504 /cm.

[α]D=+39.4° (MeOH,c=1.01,22°C).

m.p.167.0-168.0°C

No.2a-141

CDC13 300MHz

0.99(1H,d,J=10.2Hz),1.14 and 1.24(each 3H,each s),1.55-2.44(14H,m),3.84(3H,s),4.27(1H,m),5.34-5.52(2H,m),6.28(1H,d,J=9.0Hz),6.91 and 7.47(each 2H,each d,J=9.0Hz),6.98 and 7.14(each 1H,each d,J=16.5Hz),7.54 and 7.70(each 2H,eachd,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3453,3025,3015,2925,2870,2839,1740,1708,1649,1602,1510,1493,1470 /cm.

[α]D=+73.4° (MeOH,c=1.02,22°C).

m.p.155.0-157.0°C

No.2a-142

CDC13 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.23(each 3H,each s),1.52-2.45(14H,m),3.79(3H,s),4.27(1H,m),5.34-5.50(2H,m),6.24(1H,d,J=9.0Hz),6.49 and 6.62(each 1H,each d,J=12.3Hz),6.77 and 7.16(each 2H,each d,J=8.7Hz),7.32 and 7.59(each 2H,eachd,J=8.1Hz).

IR(CHCl₃):3453,3025,3014,2925,2870,2839,1739,1708,1649,1606,1510,1494 /cm.

[α]D=+60.7° (MeOH,c=0.99,22°C).

No.2a-143

$[\alpha]_D^{23} = +57.3^\circ$ (MeOH, $c=1.01$, 23°C).

No.2a-144

$[\alpha]_D^{23} = +12.2^\circ$ (MeOH, $c=1.00$, 23°C).

m.p. $114.0-116.0^\circ\text{C}$

No.2a-145

CDCl_3 300MHz

0.95(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.10 and 1.21(each 3H, each s), 1.52-2.44(14H, m), 4.25(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 6.37(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.45-7.47(3H, m), 7.62-7.66(2H, m), 7.69 and 7.80(each 2H, each d, $J=7.5\text{Hz}$).

IR(CHCl_3): 3449, 3058, 3027, 3012, 2925, 2870, 1708, 1655, 1513, 1481, 1043 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{23} = +61.0^\circ$ (MeOH, $c=1.01$, 23°C).

No.2a-146

CDCl_3 300MHz

0.95(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.41(14H, m), 4.25(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 6.33(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.49-7.61(3H, m), 7.91-7.92(2H, m), 7.82 and 7.97(each 2H, each d, $J=8.7\text{Hz}$).

IR(CHCl_3): 3447, 3029, 3023, 3015, 2925, 2870, 1708, 1660, 1514, 1484, 1321, 1161 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{22} = +62.0^\circ$ (MeOH, $c=1.00$, 22°C).

No.2a-147

IR(CHCl₃):3453,3027,3015,2925,2870,2665,1708,1648,1596,1516,1484 /cm.

[α]D=+67.7° (MeOH,c=0.82,22°C).

No.2a-148

[α]D=+72.5° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-149

[α]D=+67.8° (MeOH,c=0.98,25°C).

No.2a-150

CDCl₃ 300MHz

0.94(1H,d,J=10.2Hz),1.10 and 1.23(each 3H,each s),1.52-2.50(14H,m),4.22(1H,m),5.36-5.55(2H,m),6.48(1H,d,J=8.4Hz),8.35(1H,s),8.90(1H,s).

IR(CHCl₃):3443,3374,3091,3024,3012,2925,2871,1709,1652,1525,1494 /cm.

[α]D=+58.1° (MeOH,c=1.01,23°C).

m.p.120.0-122.0°C

No.2a-151

[α]D=+40.6° (MeOH,c=1.01,23°C).

No.2a-152

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.5Hz),1.10 and 1.24(each 3H,each s),1.50-2.50(14H,m),2.71(3H,s),4.26(1H,m),5.37-5.51(2H,m),6.02(1H,d,J=9.0Hz),8.73(1H,s).

IR(CHCl₃):3463,3435,3087,3025,3014,2925,2870,1708,1649,1523,1503 /cm.

[α]D=+54.1° (MeOH,c=1.02,22°C).

No.2a-153

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=9.9Hz),1.11 and 1.23(each 3H,each s),1.50-2.50(14H,m),2.50(3H,s),4.26(1H,m),5.36-5.51(2H,m),6.01(1H,d,J=8.4Hz),6.88(1H,d,J=5.1Hz),7.26(1H,d,J=5.1Hz).

IR(CHCl₃):3469,3431,3025,3013,2925,2871,2664,1708,1639,1544,1505 /cm.

[α]D=+35.8° (MeOH,c=1.03,22°C).

No.2a-154

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=9.9Hz),1.10 and 1.22(each 3H,each s),1.52-2.46(14H,m),2.51(3H,d,J=1.2Hz),4.26(1H,m),5.34-5.50(2H,m),6.00(1H,d,J=8.4Hz),6.73(1H,dd,J=5.1 and 3.6Hz),7.29(1H,d,J=3.6Hz).

IR(CHCl₃):3450,3431,3026,3011,2925,2869,1739,1708,1639,1547,1508 /cm.

[α]D=+50.5° (MeOH,c=1.01,22°C).

No.2a-155

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H,d,J=10.2Hz),1.19 and 1.25(each 3H,each s),1.53-2.48(14H,m),4.31(1H,m),5.36-5.51(2H,m),6.79(1H,d,J=9.3Hz),7.29(1H,m),7.41(1H,m),7.48(1H,s),7.51(1H,m),7.66(1H,d,J=8.1Hz).

IR(CHCl₃):3436,3029,3024,3015,2925,2871,2670,1708,1659,1598,1510 /cm.

[α]D=+69.1° (MeOH,c=1.01,22°C).

No.2a-156

CDCl₃:CD₃OD=10:1 300MHz

0.99(1H,d,J=9.9Hz),1.11 and 1.21(each 3H,each s),1.56-2.58(14H,m),4.22(1H,m),5.35-5.59(2H,m),6.83(1H,d,J=8.4Hz),7.48(1H,d,J=8.4Hz),7.61(1H,dd,J=1.5 and 8.4Hz),8.09(1H,d,J=1.5Hz),8.12(1H,s).

IR(KBr):3422,3115,2985,2922,2869,2609,1708,1636,1578,1529,1470 /cm.

[α]D=+62.8° (MeOH,c=1.01,22°C).

No.2a-157

$[\alpha]_D^{+40.0^\circ}$ (MeOH, c=0.95, 22°C).

No.2a-158

CDCl₃ 300MHz

1.00(1H, d, J=10.5Hz), 1.17 and 1.24(each 3H, each s), 1.54-2.50(14H, m), 4.34(1H, m), 5.36-5.52(2H, m), 7.80(1H, d, J=9.0Hz), 9.30(1H, s).

IR(CHCl₃): 3410, 3122, 3030, 3012, 2925, 2871, 2668, 1709, 1667, 1538, 1466 /cm.

$[\alpha]_D^{+44.9^\circ}$ (MeOH, c=0.99, 22°C).

No.2a-159

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H, d, J=10.2Hz), 1.13 and 1.22(each 3H, each s), 1.55-2.43(14H, m), 3.03(6H, s), 4.23(1H, m), 5.32-5.51(2H, m), 6.16(1H, d, J=8.7Hz), 6.87 and 7.63(each 2H, each d, J=8.7Hz).

IR(CHCl₃): 3457, 3028, 3006, 2924, 2870, 2654, 1739, 1709, 1637, 1608, 1608, 1534, 1501 /cm.

$[\alpha]_D^{+64.8^\circ}$ (MeOH, c=1.01, 22°C).

No.2a-160

d₆-DMSO 300MHz

0.83(1H, d, J=9.9Hz), 1.02 and 1.19(each 3H, each s), 1.38-1.61(3H, m), 1.90-2.32(11H, m), 3.90(1H, m), 5.41-5.44(2H, m), 7.32(1H, dd, J=0.9 and 7.2Hz), 7.45-7.60(2H, m), 7.77(1H, dd, J=0.9 and 7.8Hz), 8.03(1H, d, J=6.9Hz), 12.40(1H, s).

IR(Nujol): 3315, 2924, 2856, 2656, 2535, 1737, 1703, 1637, 1598, 1581, 1541 /cm.

$[\alpha]_D^{+78.5^\circ}$ (MeOH, c=1.01, 24°C).

m.p. 161.0-162.0°C

No.2a-161

$[\alpha]_D^{25} = +65.3^\circ$ (MeOH, $c=1.00$, 22°C).

No.2a-162

CDCl_3 300MHz

0.99(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.13 and 1.25(each 3H, each s), 1.53-2.45(14H, m), 4.30(1H, m), 5.36-5.51(2H, m), 6.32(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.88 and 8.28(each 2H, each d, $J=9.0\text{Hz}$).

IR(CHCl_3): 3448, 3029, 3016, 2925, 2870, 1708, 1664, 1602, 1527, 1484, 1347 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +72.7^\circ$ (MeOH, $c=1.02$, 22°C).

No.2a-163

CDCl_3 300MHz

0.96(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.11 and 1.23(each 3H, each s), 1.55-2.51(14H, m), 4.26(1H, m), 5.36-5.57(2H, m), 6.68(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.41(1H, dd, $J=4.8$ and 8.1Hz), 8.20(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 8.66(1H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 9.00(1H, s).

IR(CHCl_3): 3448, 3026, 3013, 2925, 2870, 2534, 1709, 1658, 1590, 1515, 1471 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25} = +71.3^\circ$ (MeOH, $c=1.01$, 22°C).

No.2a-164

$[\alpha]_D^{25} = +40.8^\circ$ (MeOH, $c=0.98$, 22°C).

No.2a-165

CDCl_3 300MHz

0.96(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.11 and 1.24(each 3H, each s), 1.55-2.52(14H, m), 4.24(1H, m), 5.37-5.57(2H, m), 6.63(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.59 and 8.63(each 2H each d, $J=6.0\text{Hz}$).

IR(CHCl_3): 3447, 3346, 3028, 3016, 2925, 2870, 2538, 1941, 1708, 1662, 1556, 1516 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{+75.4}$ (MeOH, c=1.01, 22°C).

No.2a-166

CDC13 300MHz

0.97(1H, d, J=10.2Hz), 1.11 and 1.22(each 3H, each s), 1.51-2.44(14H, m), 2.95(6H, s), 4.25(1H, m), 5.33-5.50(2H, m), 6.19(1H, d, J=8.7Hz), 6.77 and 6.97(each 2H, each d, J=8.4Hz), 6.94 and 7.65(each 2H, each d, J=9.0Hz).

IR(CHCl₃): 3453, 3024, 3016, 2924, 2871, 2806, 1739, 1708, 1647, 1612, 1604, 1515, 1490 /cm.

$[\alpha]_D^{+53.1}$ (MeOH, c=1.02, 23°C).

m.p. 104.0-105.5°C

No.2a-167

CDC13 300MHz

1.01(1H, d, J=9.9Hz), 1.19 and 1.26(each 3H, each s), 1.56-2.53(14H, m), 4.37(1H, m), 5.35-5.55(2H, m), 6.47(1H, d, J=8.4Hz), 7.61-7.71(2H, m), 7.79(2H, s), 7.89-7.97(2H, m), 8.27(1H, d, J=2.1Hz), 8.66-8.73(2H, m).

IR(CHCl₃): 3450, 3024, 3014, 2925, 2870, 2667, 1707, 1650, 1531, 1509 /cm.

$[\alpha]_D^{+70.5}$ (MeOH, c=1.00, 22°C).

No.2a-168

CDC13 300MHz

1.02(1H, d, J=10.2Hz), 1.20 and 1.26(each 3H, each s), 1.56-2.50(14H, m), 4.38(1H, m), 5.36-5.56(2H, m), 6.51(1H, d, J=8.4Hz), 7.61-7.93(7H, m), 8.74(1H, d, J=8.4Hz), 9.15(1H, s).

IR(CHCl₃): 3517, 3451, 3060, 3028, 3011, 2925, 2870, 2664, 1709, 1651, 1519, 1498/cm.

$[\alpha]_D^{+54.4}$ (MeOH, c=1.00, 23°C).

No.2a-169

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.5Hz),1.09 and 1.21(each 3H,each s),1.50-2.44(14H,m),3.85(3H,s),4.24(1H,m),5.32-5.48(2H,m),6.19(1H,d,J=8.4Hz),6.94 and 7.45(each 2H,each d,J=9.0Hz),7.11 and 7.45(each 2H,each d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3516,3453,3029,3009,2925,2870,2840,2665,1708,1650,1593,1515,1493,1482 /cm.

[α]D=+57.8° (MeOH,c=1.00,23°C).

No.2a-170

CDCl₃ 300MHz

0.98(1H,d,J=10.2Hz),1.15 and 1.24(each 3H,each s),1.52-2.50(14H,m),4.28(1H,m),5.33-5.54(2H,m),6.25(1H,d,J=8.2Hz),7.38-7.44(2H,m),7.74(1H,s),7.81-7.86(2H,m).

IR(CHCl₃):3517,3448,3427,3024,3013,2925,2870,2669,1708,1650,1562,1535,1500 /cm.

[α]D=+61.6° (MeOH,c=1.00,23°C).

No.2a-171

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.22(each 3H,each s),1.52-2.42(14H,m),2.48(3H,s),4.21(1H,m),5.31-5.52(2H,m),6.06(1H,d,J=8.2Hz),6.97 and 7.59(each 1H,each d,J=1.2Hz).

IR(CHCl₃):3452,3113,3028,3007,2925,2870,2669,1708,1645,1554,1509 /cm.

[α]D=+52.4° (MeOH,c=1.00,23°C).

No.2a-172

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.2Hz),1.09 and 1.28(each 3H,each s),1.50-2.40(14H,m),2.69(3

10/01/005
H,s),4.24(1H,m),5.35-5.51(2H,m),5.96(1H,d,J=8.7Hz),7.03 and 7.07(each 1H, each d,J=5.4Hz).

IR(CHCl₃):3451,3031,3013,2925,2870,2666,1708,1647,1542,1497 /cm.

[α]D=+51.2° (MeOH,c=1.00,23°C).

No.2a-173

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=10.2Hz),1.10 and 1.23(each 3H,each s),1.50-2.45(14H,m),4.22(1 H,m),5.35-5.49(2H,m),6.05(1H,d,J=8.4Hz),7.26 and 7.75(each 1H,each d,J=1.5Hz).

IR(CHCl₃):3451,3011,3029,3011,2925,2870,1708,1652,1538,1500 /cm.

[α]D=+50.6° (MeOH,c=1.01,23°C).

No.2a-174

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.2Hz),1.13 and 1.23(each 3H,each s),1.52-2.50(14H,m),4.29(1 H,m),5.35-5.51(2H,m),7.02(1H,d,J=8.4Hz),7.32 and 8.16(each 1H,each d,J=3.9Hz).

IR(CHCl₃):3417,3115,3023,3014,2925,2870,1708,1645,1530 /cm.

[α]D=+48.8° (MeOH,c=1.02,23°C).

No.2a-175

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.14 and 1.23(each 3H,each s),1.50-2.52(14H,m),2.52(3 H,s),4.29(1H,m),5.34-5.51(2H,m),7.78(1H,d,J=9.0Hz),7.24 and 7.52(each 1H, each d,J=5.4Hz).

IR(CHCl₃):3329,3093,3023,3015,2924,2871,1708,1640,1526 /cm.

[α]D=+45.0° (MeOH,c=1.01,23°C).

No.2a-176

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=10.5Hz), 1.09 and 1.23(each 3H,each s), 1.52-2.46(14H,m), 2.40(3H,d,J=0.9Hz), 4.24(1H,m), 5.35-5.51(2H,m), 6.05(1H,d,J=8.7Hz), 6.95(1H,m), 7.57(1H,d,J=3.3Hz).

IR(CHCl₃): 3517, 3444, 3103, 3024, 3013, 2926, 2870, 1739, 1708, 1649, 1636, 1507/cm.

[α]_D=+54.8° (MeOH, c=1.01, 23°C).

m.p. 97.0-99.0°C

No.2a-177

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz), 1.11 and 1.23(each 3H,each s), 1.52-2.45(14H,m), 3.93(3H,s), 4.27(1H,m), 5.34-5.50(2H,m), 6.35(1H,d,J=3.3Hz), 7.80(1H,d,J=8.7Hz), 8.10(1H,d,J=3.3Hz).

IR(CHCl₃): 3395, 3121, 3031, 3019, 3012, 2925, 2871, 1739, 1709, 1640, 1557, 1533 /cm.

[α]_D=+22.8° (MeOH, c=1.01, 23°C).

m.p. 109.0-112.0°C

No.2a-178

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.5Hz), 1.10 and 1.23(each 3H,each s), 1.51-2.45(14H,m), 4.24(1H,m), 5.35-5.50(2H,m), 6.09(1H,d,J=8.4Hz), 7.17-7.31(6H,m), 7.95(1H,d,J=1.5Hz).

IR(CHCl₃): 3510, 3451, 3062, 3031, 3022, 3011, 2925, 2870, 2662, 1708, 1651, 1582, 1535, 1497, 1477/cm.

[α]_D=+47.9° (MeOH, c=1.01, 25°C).

No.2a-179

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.2Hz),1.14 and 1.24(each 3H,each s),1.52-2.48(14H,m),4.30(1H,m),5.36-5.52(2H,m),6.73(1H,d,J=9.0Hz),6.26 and 7.37(each 1H,each d,J=6.0Hz).

IR(CHCl₃):3509,3429,3115,3094,3025,3014,2925,2871,2666,1708,1649,1529,1510 /cm.

[α]_D=+51.0° (MeOH,c=1.02,25°C).

No.2a-180

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=10.2Hz),1.14 and 1.24(each 3H,each s),1.52-2.46(14H,m),3.89(3H,s),4.21(1H,m),5.35-5.50(2H,m),6.05(1H,d,J=8.4Hz),6.46 and 7.04(each 1H,each d,J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3516,3450,3114,3031,3010,2925,2871,1708,1648,1546,1511,1477 /cm.

[α]_D=+49.1° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-181

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.14 and 1.23(each 3H,each s),1.52-2.48(14H,m),2.42(3H,s),4.31(1H,m),5.34-5.52(2H,m),8.07(1H,d,J=9.3Hz),7.27 and 8.17(each 1H,each d,J=3.3Hz).

IR(CHCl₃):3510,3301,3112,3023,3007,2924,2871,2663,1708,1636,1534 /cm.

[α]_D=+41.0° (MeOH,c=0.96,25°C).

No.2a-182

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.23(each 3H,each s),1.53-2.46(14H,m),2.51(3

H,s),4.21(1H,m),5.35-5.51(2H,m),6.05(1H,d,J=8.1Hz),7.26 and 7.78(each 1H, each d,J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3509,3450,3109,3024,3012,2925,2870,2666,1708,1650,1535,1498,1471 /cm.

[α]D=+52.9° (MeOH,c=0.95,25°C).

No.2a-183

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.5Hz),1.12 and 1.22(each 3H,each s),1.52-2.46(14H,m),4.25(1H,m),5.33-5.51(2H,m),6.17(1H,d,J=8.7Hz),7.01-7.05(3H,m),7.14 and 7.62(each 2H,each d,J=8.7Hz),7.27-7.34(2H,m).

IR(CHCl₃):3428,3026,3015,2925,2870,2666,1739,1708,1643,1613,1594,1526,1499 /cm.

[α]D=+64.8° (MeOH,c=1.02,23°C).

No.2a-184

CDCl₃ 300MHz

1.01(1H,d,J=10.2Hz),1.18 and 1.26(each 3H,each s),1.55-2.50(14H,m),4.35(1H,m),5.35-5.55(2H,m),6.42(1H,d,J=8.7Hz),7.46-7.52(2H,m),7.73(1H,dd,J=1.8 and 8.4Hz),7.83-7.89(2H,m),8.21(1H,m),8.59(1H,d,J=1.5Hz).

IR(CHCl₃):3451,3031,3014,2925,2870,2660,1739,1708,1650,1604,1513,1463 /cm.

[α]D=+58.3° (MeOH,c=1.00,23°C).

No.2a-185

CDCl₃ 300MHz

1.00(1H,d,J=10.2Hz),1.18 and 1.25(each 3H,each s),1.55-2.50(14H,m),4.34(1H,m),5.35-5.54(2H,m),6.36(1H,d,J=8.7Hz),7.37(1H,t,J=7.4Hz),7.50(1H,m),7.57-7.59(2H,m),7.79(1H,dd,J=1.8 and 8.1Hz),7.99(1H,d,J=7.8Hz),8.39(1H,d,J=

1.8Hz).

IR(CHCl₃):3451,3030,3020,2870,2665,1708,1652,1632,1603,1586,1514,1469,1448 /cm.

[α]D=+59.4° (MeOH,c=1.01,24°C).

No.2a-186

CDCl₃ 300MHz

1.00(1H,d,J=10.5Hz),1.17 and 1.25(each 3H,each s),1.54-2.50(14H,m),4.33(1H,m),5.35-5.54(2H,m),6.37(1H,d,J=8.7Hz),7.37(1H,t,J=7.4Hz),7.51(1H,t,J=7.8Hz),7.56(1H,m),7.70(1H,dd,J=1.2 and 8.4Hz),7.97(3H,m).

IR(CHCl₃):3451,3030,3014,2924,2870,2671,1739,1708,1652,1577,1517,1488,1471 /cm.

[α]D=+72.2° (MeOH,c=1.00,24°C).

No.2a-187

CDCl₃ 300MHz

1.00(1H,d,J=9.8Hz),1.18 and 1.25(each 3H,each s),1.54-2.53(14H,m),4.07(3H,s),4.37(1H,m),5.30-5.54(2H,m),7.34(1H,m),7.47(1H,s),7.47-7.60(2H,m),7.93(1H,d,J=7.8Hz),8.43(1H,s),8.49(1H,d,J=9.0Hz).

IR(CHCl₃):3397,3074,3027,3020,3009,2924,1738,1708,1647,1633,1534,1465,1453 /cm.

[α]D=+43.7° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-188

CDCl₃ 300MHz

0.97(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.23(each 3H,each s),1.53-2.50(14H,m),4.23(1H,m),5.37-5.50(2H,m),6.10(1H,d,J=9.0Hz),6.20(1H,m),6.51(1H,m),6.97(1H,m),10.81(1H,bs).

IR(CHCl₃):3450,3236,3112,3029,3015,2925,2871,2645,1701,1616,1558,1516

/cm.

$[\alpha]_D^{+50.6}$ (MeOH, $c=1.01$, 24°C).

No.2a-189

CDCl₃ 300MHz

0.94(1H,d, $J=9.9\text{Hz}$), 1.11 and 1.23(each 3H,each s), 1.50-2.46(14H,m), 3.93(3H,s), 4.18(1H,m), 5.35-5.52(2H,m), 6.03(1H,d, $J=9.3\text{Hz}$), 6.09(1H,m), 6.48(1H,m), 6.73(1H,m).

IR(CHCl₃): 3452, 3102, 3028, 3007, 2925, 2871, 2666, 1739, 1708, 1650, 1536, 1499, 1471 /cm.

$[\alpha]_D^{+49.8}$ (MeOH, $c=1.01$, 23°C).

m.p. 101.5-103.5 $^\circ\text{C}$

No.2a-190

CDCl₃ 300MHz

0.94(1H,d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.11 and 1.21(each 3H,each s), 1.54-2.47(14H,m), 4.23(1H,m), 5.33-5.52(2H,m), 6.06(1H,d, $J=9.0\text{Hz}$), 6.34(1H,m), 6.75(1H,m), 6.36(1H,m), 9.71(1H,bs).

IR(CHCl₃): 3470, 3215, 3030, 3020, 3010, 2925, 2871, 2664, 1709, 1613, 1564, 1510 /cm.

$[\alpha]_D^{+43.3}$ (MeOH, $c=1.01$, 24°C).

No.2a-191

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.11 and 1.22(each 3H,each s), 1.55-2.44(14H,m), 3.66(3H,s), 4.20(1H,m), 5.35-5.51(2H,m), 5.93(1H,d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.27(1H,dd, $J=1.8$ and 2.7Hz), 6.56(1H,t, $J=2.7\text{Hz}$), 7.19(1H,t, $J=1.8\text{Hz}$).

IR(CHCl₃): 3452, 3031, 3018, 3006, 2925, 2871, 2662, 1736, 1710, 1634, 1609, 1556, 1498 /cm.

1C17575001085
[α]D=+43.1° (MeOH,c=1.01,23°C).

No.2a-192

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.5Hz),1.11 and 1.21(each 3H,each s),1.43(3H,t,J=7.5Hz),1.54-2.44(14H,m),3.93(2H,q,J=7.5Hz),4.21(1H,m),5.33-5.51(2H,m),5.94(1H,d,J=8.4Hz),6.27(1H,dd,J=1.8 and 2.7Hz),6.62(1H,t,J=2.7Hz),7.26(1H,t,J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3630,3452,3032,3018,3006,2925,2871,2661,1735,1710,1633,1610,1555,1497 /cm.

[α]D=+40.1° (MeOH,c=1.00,23°C).

No.2a-193

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=10.2Hz),1.10 and 1.22(each 3H,each s),1.53-2.49(14H,m),2.58(3H,s),4.21(1H,m),5.35-5.54(2H,m),6.15(1H,d,J=8.1Hz),6.52(1H,dd,J=1.8 and 3.6Hz),7.29(1H,t,J=3.6Hz),7.94(1H,t,J=1.8Hz).

IR(CHCl₃):3516,3450,3410,3152,3027,3015,2925,2871,2670,1732,1648,1574,1509 /cm.

[α]D=+45.0° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-194

CDCl₃ 300MHz

0.99(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.24(each 3H,each s),1.52-2.53(14H,m),4.34(1H,m),5.33-5.57(2H,m),6.21(1H,d,J=8.6Hz),7.35-7.50(2H,m),7.83(1H,s),7.86(1H,m),8.31(1H,m).

IR(CHCl₃):3443,3067,3013,2925,2870,2665,1708,1651,1515,1493 /cm.

[α]D=+55.7° (MeOH,c=1.01,23°C).

N .2a-195

CDCI₃ 300MHz

1.01(1H,d,J=10.0Hz),1.06 and 1.26(each 3H,each s),1.50-2.64(14H,m),2.68(3H,s),4.40(1H,m),5.36-5.61(2H,m),6.02(1H,d,J=9.4Hz),7.30-7.42(2H,m),7.73-7.86(2H,m).

IR(CHCl₃):3510,3434,3062,3029,3014,2924,2871,2669,1708,1650,1563,1539,1500 /cm.

[α]D=+72.4° (MeOH,c=1.00,23°C).

m.p.111.0-112.0°C

No.2a-196

CDCI₃ 300MHz

0.42 and 1.04(each 3H,each s),0.80(1H,d,J=10.0Hz),1.11-2.48(14H,m),2.24(3H,s),4.02(1H,m),5.23-5.44(2H,m),5.53(1H,d,J=8.8Hz),7.27-7.31(2H,m),7.42-7.48(3H,m),7.93(1H,s).

IR(CHCl₃):3419,3114,3025,3006,2924,2871,2662,1737,1709,1636,1540,1519 /cm.

[α]D=+43.7° (MeOH,c=1.01,23°C).

No.2a-197

CDCI₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=10.0Hz),1.09 and 1.23(each 3H,each s),1.54-2.46(18H,m),2.77(4H,bs),4.21(1H,m),5.32-5.54(2H,m),6.02(1H,d,J=8.6Hz),7.43(1H,s).

IR(CHCl₃):3445,3101,3024,3014,2928,2865,2661,1739,1708 1646,1550,1507 /cm.

[α]D=+51.9° (MeOH,c=1.01,23°C).

No.2a-198

CDCI₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.2Hz),1.11 and 1.22(each 3H,each s),1.50-2.44(14H,m),4.24(1

H,m), 4.42(2H,s), 5.35-5.49(2H,m), 6.25(1H,d,J=8.1Hz), 7.33(1H,m), 7.43(1H,dd,J=1.5 and 7.5Hz), 7.49(1H,d,J=8.1Hz), 7.60-7.63(1H,m), 7.68(1H,dd,J=1.8 and 7.8Hz), 8.02(1H,d,J=1.8Hz), 8.19(1H,dd,J=1.5 and 8.1Hz).

IR(CHCl₃): 3448, 3030, 3012, 2925, 2870, 1739, 1708, 1671, 1588, 1559, 1514, 1472 / cm.

$[\alpha]_D^{25} = +56.9^\circ$ (MeOH, c=1.01, 24°C).

No.2a-199

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.2Hz), 1.11 and 1.22(each 3H,each s), 1.51-2.46(14H,m), 3.40(1H,m), 3.76(1H,m), 4.24(1H,m), 5.33-5.51(3H,m), 6.25(1H,m), 7.16(1H,m), 7.24-7.33(2H,m), 7.46(1H,d,J=7.5Hz), 7.52-7.60(2H,m), 7.85(1H,dd,J=1.8 and 4.5Hz).

IR(CHCl₃): 3583, 3447, 3062, 3028, 3013, 2924, 2871, 2663, 1708, 1651, 1600, 1557, 1514, 1471 / cm.

$[\alpha]_D^{25} = +54.8^\circ$ (MeOH, c=1.00, 23°C).

No.2a-200

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.2Hz), 1.12 and 1.23(each 3H,each s), 1.51-2.46(14H,m), 4.25(1H,m), 5.34-5.51(2H,m), 6.25(1H,d,J=8.4Hz), 7.02 and 7.10(each 1H,each d,J=1.8 and 2.3Hz), 7.23-7.33(4H,m), 7.50(1H,m), 7.64(1H,dd,J=1.8 and 7.8Hz), 7.82(1H,d,J=1.8Hz).

IR(CHCl₃): 3450, 3060, 3025, 3014, 2925, 2871, 2662, 1708, 1653, 1596, 1542, 1513, 1473 / cm.

$[\alpha]_D^{25} = +62.5^\circ$ (MeOH, c=1.00, 24°C).

No.2a-201

CDCl₃ 300MHz

0.95(1H,d,J=9.9Hz), 1.15 and 1.22(each 3H,each s), 1.55-2.60(14H,m), 4.26(1

H,m),5.35-5.63(2H,m),7.14(1H,d,J=9.9Hz),7.34 and 7.40(each,1H,each d,J=12.9Hz),7.62-7.73(4H,m),8.25-8.30(2H,m),8.72(1H,d,J=1.5Hz).

IR(CHCl₃):3443,3389,3297,3061,3030,3016,2925 2870,1726,1708 1652,1603,1521,1483,1472,1309 /cm.

[α]D=+61.1° (MeOH,c=1.01,23°C).

No.2a-202

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.2Hz),1.09 and 1.22(each 3H,each s),1.52-2.43(14H,m),2.63(3H,s),4.25(1H,m),5.33-5.49(2H,m),6.19(1H,d,J=8.4Hz),7.10 and 7.58(each,2H,each d,J=9.0Hz),7.21(1H,m),7.30-7.32(2H,m),7.46(1H,d,J=7.5Hz).

IR(CHCl₃):3511,3453,3062,3032,3014,2925 2870,1739,1708,1650,1595,1556,1516,1482,1471 /cm.

[α]D=+60.2° (MeOH,c=1.01,25°C).

No.2a-203

CDCl₃ 300MHz

0.96(1H,d,J=10.5Hz),1.09 and 1.23(each 3H,each s),1.52-2.43(14H,m),4.23(1H,m),5.35-5.51(2H,m),5.93(1H,d,J=8.7Hz),6.56(1H,dd,J=0.9 and 1.8Hz),7.43(1H,t,J=1.8Hz),7.92(1H,dd,J=0.9 and 1.8Hz).

IR(CHCl₃):3517,3450,3134,3031,3008,2925,2870,2667,1708,1656,1588,1570,1514 /cm.

[α]D=+46.7° (MeOH,c=0.92,25°C).

N.2b-1

No.2c-1

$[\alpha]_D = +60.5^\circ$ (MeOH, c=1.01, 22°C).

No.2c-2

$[\alpha]_D = +55.8^\circ$ (MeOH, c=0.92, 22°C).

No.2c-3

$[\alpha]_D = +54.7^\circ$ (MeOH, c=1.01, 22°C).

No.2d-1

$[\alpha]_D = -6.2^\circ$ (MeOH, c=1.00, 21°C).

No.2d-2

$[\alpha]_D = +15.8^\circ$ (MeOH, c=0.34, 22°C).

No.2d-3

$[\alpha]_D = +31.6^\circ$ (MeOH, c=1.01, 22°C).

No.2e-1

$[\alpha]_D = -9.4^\circ$ (MeOH, c=1.00, 22°C).

No.2e-2

$[\alpha]_D = -1.8^\circ$ (MeOH, c=1.02, 23°C).

No.2e-3

$[\alpha]_D = -6.7^\circ$ (MeOH, c=1.01, 23°C).

N .2f-1

$[\alpha]_D = +6.8^\circ$ (MeOH, c=1.01, 23°C).

No.2f-2

$[\alpha]_D = -2.6^\circ$ (MeOH, c=1.00, 22°C).

No.2f-3

$[\alpha]_D = -3.5^\circ$ (MeOH, c=1.01, 22°C).

No.2g-1

$[\alpha]_D = +54.6^\circ$ (MeOH, c=1.01, 24°C).

No.3a-2

CDCl₃ 300MHz

0.98-2.15(14H, m), 2.31(2H, t, J=7.2Hz), 2.35-2.40(1H, m), 3.10-3.20(1H, m),
5.00(1H, d, J=6.9Hz), 5.30-5.48(2H, m), 6.75(1H, d, J=10.2Hz), 7.38-7.52(6H, m).
IR(CDCl₃): 3266, 3028, 2954, 2874, 1709, 1620, 1448, 1412, 1318, 1141, 970, 892/cm.
 $[\alpha]_D = +20.3 \pm 0.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.05, 24°C).

No.3a-3

CDCl₃ 300MHz

0.95-2.00(14H, m), 2.20-2.29(3H, m), 3.00-3.08(1H, m), 3.66(3H, s), 5.00(1H, d,
J=6.6Hz), 5.13-5.29(2H, m), 7.38-7.52(3H, m), 7.59-7.65(2H, m), 7.69-
7.75(2H, m), 7.92-7.98(2H, m).
IR(CHCl₃): 3376, 3018, 2946, 2868, 1727, 1594, 1436, 1395, 1322, 1157, 1095, 890
/cm.

$[\alpha]_D = +2.3 \pm 0.4^\circ$ (CHCl₃, c=1.03, 22°C).

mp. 65-66.5°C

No.3a-4

CDCl₃ 300MHz

0.93-2.05(14H,m), 2.15-2.22(1H,m), 2.31(2H,t, J=7.2Hz), 3.01-3.10(1H,m),
5.18-5.31(3H,m), 7.38-7.52(3H,m), 7.58-7.66(2H,m), 7.69-7.76(2H,m), 7.92-
7.98(2H,m)

IR(CHCl₃): 3374, 3260, 3020, 2948, 2868, 1708, 1594, 1479, 1396, 1319, 1156, 1095, 1052, 891/cm.

[α]D=+13.1 \pm 0.5° (CHCl₃, c=1.16, 24°C).

No.3a-6

CD₃OD 300MHz

1.04-1.95(14H,m), 2.07(2H,t, J=7.8Hz), 2.14-2.22(1H,m), 2.94-3.00(1H,m), 5.04-
5.25(2H,m), 7.36-7.52(3H,m), 7.66-7.71(2H,m), 7.78-7.85(2H,m), 7.91-
7.97(2H,m).

IR(KBr): 3421, 3278, 2951, 2872, 1562, 1481, 1409, 1317, 1156, 1097, 1057, 895/cm.

[α]D=-15.3 \pm 0.5° (CHCl₃, c=1.06, 23°C).

mp. 105-112°C

No.3a-11

CDCl₃ 300MHz

0.90-2.04(14H,m), 2.08-2.19(1H,m), 2.35(2H,t, J=7.2Hz), 2.95-3.04(1H,m), 5.17-
5.32(3H,m), 7.56-7.63(2H,m), 7.83-7.95(2H,m).

IR(CHCl₃): 3260, 3020, 2948, 2868, 1707, 1569, 1456, 1383, 1325, 1268, 1160, 1088,
1053, 1006, 892/cm.

[α]D=+8.3 \pm 0.5° (CHCl₃, c=1.00, 22°C).

No.3a-16

CDCl₃ 300MHz

0.80-1.90(14H,m), 1.98-2.04(1H,m), 2.27(2H,t, J=7.2Hz), 2.88(6H,s), 2.90-
2.98(1H,m), 4.88-5.00(2H,m), 5.13(1H,d, J=7.2Hz), 7.18(1H,d, J=7.5Hz), 7.48-

7.60(2H,m),8.25-8.33(2H,m),8.53(1H,d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3272,3020,2946,2866,2782,1708,1573,1455,1407,1311,1229,1160,1142,1070,942,891/cm.

[α]_D=-19.7 \pm 0.6° (CHCl₃,c=1.08,23.5°C).

No.3a-31

CDCl₃ 300MHz

0.80-1.85(14H,m),2.02-2.08(1H,m),2.20(2H,t,J=7.2Hz),2.85-2.95(1H,m),3.68(3H,s),4.80-4.92(2H,m),4.96(1H,d,J=6.9Hz),7.50-7.70(3H,m),7.92-7.98(1H,m),8.07(1H,d,J=8.4Hz),8.29(1H,dd,J=1.5&7.5Hz),8.65(1H,d,J=8.7Hz).

IR(CHCl₃):3374,3016,2946,2868,1727,1506,1435,1318,1160,1133,1105,1051,984,890/cm.

[α]_D=-39.3 \pm 0.8° (CHCl₃,c=1.07,22°C).

No.3a-32

CDCl₃ 300MHz

0.80-1.90(14H,m),1.95-2.05(1H,m),2.27(2H,t,J=7.2Hz),2.90-2.96(1H,m),4.85-5.00(2H,m),5.23(1H,d,J=6.6Hz),7.50-7.72(3H,m),7.95(1H,d,J=8.1Hz),8.07(1H,d,J=8.4Hz),8.29(1H,dd,J=1.2&7.5Hz),8.66(1H,d,J=9.0Hz).

IR(CHCl₃):3270,3020,2948,2868,1708,1455,1412,1317,1159,1132,1104,1079,1051,983,891/cm.

[α]_D=-29.2 \pm 0.6° (CHCl₃,c=1.08,22°C).

No.3a-33

CD₃OD 300MHz

0.94-1.84(14H,m),1.96-2.08(3H,m),2.77-2.84(1H,m),4.67-4.84(2H,m),7.55-7.75(3H,m),8.02(1H,d,J=7.8Hz),8.12-8.26(2H,m),8.74(1H,d,J=8.7Hz).

IR(KBr):3432,3298,2951,2872,1564,1412,1315,1159,1134,1107,1082,1058,

986/cm.

$[\alpha]_D = -79.9 \pm 1.2^\circ$ (CH₃OH, $c=1.00$, 23°C).

No.3a-34

CDCl₃ 300MHz

0.97-1.91(14H,m), 2.13-2.20(1H,m), 2.42(2H,t, $J=7.2$ Hz), 3.00-3.07(1H,m), 5.06-5.24(2H,m), 5.33(1H,d, $J=6.9$ Hz), 7.57-7.68(2H,m), 7.82-8.00(4H,m), 8.45(1H,d, $J=1.2$ Hz)

IR(CHCl₃): 3260, 3020, 2948, 1708, 1408, 1319, 1154, 1129, 1073, 953, 893/cm.

$[\alpha]_D = +20.7 \pm 0.6^\circ$ (CHCl₃, $c=1.07$, 22°C).

No.3a-35

CD₃OD 300MHz

1.03-2.20(m, 17H), 2.97(m, 1H), 5.02(m, 2H), 7.64(m, 2H), 8.00(m, 4H), 8.43(S, 1H).

IR(KBr): 3360, 3285, 1562, 1407, 1316, 1153, 1130, 1075/cm.

$[\alpha]_D = 0$

$[\alpha]_{365} = +20.9 \pm 0.6^\circ$ (CH₃OH, $c=1.04$, 23°C).

No.3d-1

CDCl₃ 300MHz

0.93-2.55(m, 17H), 3.02(m, 1H), 5.24(m, 2H), 6.48(m, 1H), 7.35-7.60(m, 3H), 7.85-8.00(m, 2H)

IR(Nujol): 3275, 1548, 1160, 1094, 758, 719, 689, 591, 557/cm.

$[\alpha]_D = +19.0 \pm 0.6^\circ$ (CH₃OH, $c=1.010$, 26.5°C).

元素分析(C₂₀H₂₆NO₄S · 1/2 Ca · 1.0 H₂Oとして)

計算値: C, 57.94; H, 6.82; N, 3.38; Ca, 4.83;
H₂O, 4.35

実測値: C, 57.80; H, 6.68; N, 3.68; Ca, 5.06;
H₂O, 4.50

No.3d-6

$[\alpha]_D = -20.7 \pm 0.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.00, 24°C).

No.3d-7

$[\alpha]_D = -3.2 \pm 0.4^\circ$ (CHCl₃:c=1.03, 22°C).

mp.65-67°C

No.3d-8

$[\alpha]_D = -14.5 \pm 0.5^\circ$ (CHCl₃, c=1.07, 24°C).

No.3d-9

$[\alpha]_D = +12.2 \pm 0.5^\circ$ (CH₃OH, c=1.00, 23°C).

mp.119-125°C

No.3d-10

$[\alpha]_D = +39.7 \pm 0.8^\circ$ (CHCl₃, c=1.07, 22°C).

No.3d-11

$[\alpha]_D = +29.2 \pm 0.7^\circ$ (CHCl₃, c=1.06, 22°C).

No.3d-12

$[\alpha]_D = +76.4 \pm 1.1^\circ$ (CH₃OH, c=1.03, 24°C).

No.3d-14

$[\alpha]_D = -20.6 \pm 0.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.07, 22°C).

No.3d-15

$[\alpha]_{365} = -28.0 \pm 0.7^\circ$ (CH₃OH, c=1.03, 24.5°C).

No.3d-16

$[\alpha]_D = -8.7 \pm 0.5^\circ$ (CHCl₃, c=1.06, 22°C).

No.3d-17

CDCl₃ 300MHz

0.80-2.15(m, 24H), 2.32(t, J=7Hz, 2H), 2.68(t, J=7Hz, 2H), 3.02(m, 1H), 2.15
(m, 24H), 2.32(t, J=7Hz, 2H), 2.68(t, J=7Hz, 2H), 3.02(m, 1H), 5.22(m, 2H), 5.38(d, J=
7Hz, 1H), 7.30(A2B2q-Apart, J=8Hz, 2H), 7.81(A2B2qBpart, J=8Hz, 2H), 9.86
(br.s, 1H).

$[\alpha]_D \approx 0$

$[\alpha]_{365} = -9.7 \pm 0.5^\circ$ (CHCl₃, c=1.03, 22°C).

No.3d-24

$[\alpha]_D = +19.2 \pm 0.6^\circ$ (CHCl₃, c=1.05, 23°C).

No.3d-26

CD₃OD 300MHz

0.90-2.20(20H, m), 2.88(1H, m), 3.07(2H, q, J=7.0Hz), 5.00-5.40(2H, m), 7.20-
7.60(4H, m), 7.95(1H, m).

IR(KBr): 3415, 3254, 1698, 1564, 1314, 1154/cm.

No.3d-28

CD₃OD 300MHz

0.90-2.20(20H, m), 2.73(2H, q, J=7.0Hz), 2.93(1H, m), 5.00-5.30(2H, m), 7.40-
7.50(2H, m), 7.60-7.77(2H, m).

IR(KBr): 3435, 3280, 1562, 1323, 1304, 1151/cm.

No.3d-30

元素分析 $C_{20}H_{25}BrNO_4SNa$

Calc. C50.21; H5.27; Br16.70; N2.93; S6.70; Na4.81

found. C50.22; H5.40; Br15.57; N2.88; S6.41; Na5.10

IR(KBr): 3425, 3280, 3085, 1697, 1570, 1410, 1321, 1165, 1155/cm.

No.3e-1

CD_3OD 300MHz

0.71(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.04(3H, s), 1.12(3H, s), 1.35-2.28(14H, m), 2.42(3H, s), 3.17-3.25(1H, m), 5.18-5.39(2H, m), 7.37(2H, d, $J=8.4Hz$), 7.75(2H, d, $J=8.4Hz$).

IR($CHCl_3$): 3400, 3289, 2986, 2924, 2870, 1559, 1424, 1322, 1305, 1160, 1095, 1075, 1030/cm.

$[\alpha]_D^{25} = +25.9 \pm 0.7^\circ$ (CH_3OH , $c=1.00$, $23^\circ C$).

上記実施例で得た化合物につき、以下の実験例に示す方法で、インビボ及びインビトロ活性を試験した。

実験例 1 PGD_2 受容体の結合実験

試験材料及び試験方法

(1) ヒト血小板膜画分の調製

健康人（成人男性及び女性）の静脈より 3.8 % クエン酸ナトリウムの入ったプラスチック製シリンジにて採血した血液をプラスチック製試験管に入れ、軽く転倒混和した後、室温で、1800 rpm、10 分間遠心分離し、上清の多血小板血漿 [PRP (Platelet rich plasma)] を採取した。この PRP をさらに室温、2300 rpm、22 分間の遠心分離に付し、血小板を得た。得られた血小板は homogenizer (Ultra-Turrax) を用いてホモジナイズした後、4℃、20000 rpm、10 分間遠心分離を 3 回行い、血小板膜画分を得た。膜画分は蛋白定量後、2 mg/ml とし、結合実験に供するまで -80℃ で冷凍保存した。

(2) PGD_2 受容体の結合実験

結合反応液 (50 mM Tris/HCl, pH 7.4, 5 mM MgCl_2) 0.2 ml に、ヒト血小板膜画分 (0.1 mg) 及び 5 nM [^3H] PGD_2 (115 Ci/mmol) を加え、4℃ で 90 分間反応させた。反応後ガラス繊維濾紙を用いて濾過し、冷生理食塩水で数回洗浄し、濾紙に残った放射活性を測定した。特異的結合量は全結合量から非特異的結合量 (10 μM PGD_2 存在下での結合量) を差し引いた値とした。各化合物の結合阻害活性は、化合物非存在下での結合量を 100 % とし、各化合物存在下での結合量 (%) を求めて置換曲線を作成することにより、50 % 抑制濃度 (IC_{50} 値) を算出した。結果を以下に示す。

化合物番号	結合活性 (μM)	化合物番号	結合活性 (μM)
3a-4	0.6	2a-4	0.54
1a-115	8.6	2a-17	0.12
1a-28	0.045	2a-21	5.2
1a-47	0.0086	2a-28	0.046

1a-100	0. 5 6	2a-95	1. 6
1a-176	0. 0 4 7	2a-109	0. 0 0 3
1a-2	0. 1 3		
1a-162	0. 0 2 7		

実験例2 ヒト血小板を使ったPGD₂受容体の拮抗活性

あらかじめ1/9量のクエン酸ーデキストロース液を添加したシリンジで健康人から末梢血を採取し、180gで10分間遠心した後、上清（PRP: platelet rich plasma）を採取する。得られたPRPを洗浄バッファーで3回遠心洗浄した後、血小板数をマイクロセルカウンターでカウントする。最終濃度 5×10^8 個/mlとなるように調製した血小板浮遊液を37℃に加温後、3-イソブチル-1-メチルキサンチン（0.5 mM）で5分間前処置し、種々の濃度に希釈した化合物を添加し、その10分後に0.1~2.0 μ MのPGD₂を添加して反応を惹起した。15分後に塩酸を加えて反応を停止し、超音波ホモジナイザーにて血小板を破壊し、遠心後その上清中のcAMPを放射アッセイにて定量する。薬物のPGD₂受容体拮抗活性はPGD₂添加によって増加したcAMP量に対する抑制率を各濃度で求め、50%の阻害を示す薬物濃度を算出して評価した。結果を以下に示す。

化合物番号 ヒト血小板 cAMP 上昇阻害 IC₅₀ (μ M)

3a-16	0. 3 7
1a-121	2. 1 1
1a-28	0. 3 0
1a-47	2. 0 9
2a-2	0. 7 7
2a-4	0. 9 4
2a-35	1. 5 2
2a-75	0. 7 1

実験例 3 鼻閉モデルによる実験

モルモットを用いる鼻腔抵抗の測定及び抗鼻閉作用の評価の方法を以下に示す。

1. %卵白アルブミン (OVA) 溶液を超音波ネブライザーでエアロゾル化し、これをハートレイ (Hartley) 系雄性モルモットに1週間隔で2回、各10分間吸入させて感作し、その7日後に抗原を暴露して反応を惹起した。ペントバルビタール (30 mg/kg, i.p.) 麻酔下にモルモットの気管を切開して鼻腔側と肺側にそれぞれカニューレを装着し、肺側には毎分60回、1回4 mlの空気を送気する人工呼吸器を接続した。ガラミン (2 mg/kg, i.v.) でモルモットの自発呼吸を停止させた後、鼻腔側のカニューレより人工呼吸器を用いて毎分70回、1回4 mlの空気を鼻吻側に送り、この送気に必要な空気圧を側枝に装着したトランスデューサーを介して測定し、鼻腔抵抗の指標とした。抗原の暴露は3% OVA溶液のエアロゾルを人工呼吸器と鼻腔カニューレの間に3分間発生させることにより行った。被検薬物は抗原暴露の10分前に静注した。成績は0から30分間の鼻腔抵抗を連続的に測定し、その30分間のAUC (縦軸に鼻腔抵抗 (cm H₂O)、横軸に時間 (0~30分間)) を指標に、ピークルに対する抑制率として表示した。結果を以下に示す。

化合物番号	抑制率 (%)	備考
<hr/>		
	1 mg/Kg(i.v.)	
1a-28	44	
1a-98	69	
1a-100	50	
1a-115	66	
1a-116	48	
1a-120	58	3mg/Kg(i.v.)
1a-2	82	
1a-162	80	
1a-176	60	
1a-267	62	

2a-4	6 0	
2a-21	5 2	
2a-28	5 4	
2a-95	7 7	
2a-96	7 7	10mg/Kg(p.o.)
2a-109	7 3	
2a-110	6 6	10mg/Kg(p.o.)
2a-194	7 9	

製剤例 1

錠剤の製造

40 mg の有効成分を含有する錠剤を常法により製造した。40 mg 錠の組成を以下に示す。

(+) - (Z) - 7 - [(1 R, 2 S, 3 S, 4 S) - 3 - ベンゼンスルホンアミドピシクロ[2. 2. 1]ヘプト - 2 - イル] - 5 - ヘプテン酸カルシウム二水和物	40. 0 mg
ヒドロキシプロピルセルロース	3. 6 mg
ステアリン酸マグネシウム	0. 4 mg
トウモロコシデンプン	18. 0 mg
乳糖	58. 0 mg
合計	120. 0 mg

製剤例 2

顆粒剤の製造

(+) - (Z) - 7 - [(1 R, 2 S, 3 S, 4 S) - 3 - ベンゼンスルホンアミドピシクロ[2. 2. 1]ヘプト - 2 - イル] - 5 - ヘプテン酸カルシウム二水和物	100. 0 mg
ヒドロキシプロピルセルロース	30. 0 mg
カルメロースカルシウム	30. 0 mg
タルク	10. 0 mg

ボロクサマー 188

20.0mg

結晶セルロース

70.0mg

トウモロコシデンプン

300.0mg

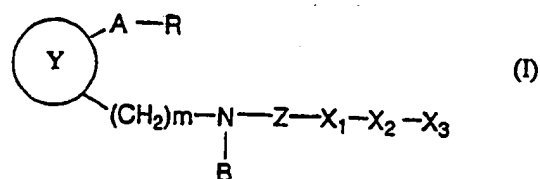
乳糖

440.0mg

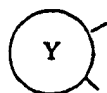
合計 1000.0mg

請 求 の 範 囲

1. 式 (I) :



(式中、



は、



を表わし、

Aはヘテロ原子もしくはフェニレンを介在していてもよく、オキシ基を有していてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよいアルキレン；

Bは水素、アルキル、アラルキルまたはアシル；

RはCOOR₁、CH₂OR₂またはCON(R₃)R₄；

R₁は水素またはアルキル；

R₂は水素またはアルキル；

R₃およびR₄はそれぞれ独立して水素、アルキル、ヒドロキシまたはアルキルシルホニル；

X₁は単結合、フェニレン、ナフチレン、チオフエンジイル、インドールジイルまたはオキサゾールジイル；

X₂は単結合、 $-\text{N}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{N}-\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-$ 、 $-\text{C}=\text{NNHCSNH}-$ 、 $-\text{C}=\text{NNHCONH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}(\text{OH})-$ 、 $-\text{C}(\text{Cl})=\text{C}(\text{Cl})-$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-$ 、エチニレン、 $-\text{N}(\text{R}_5)-$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{51})\text{CO}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{52})\text{SO}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{53})\text{CON}(\text{R}_{54})-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}_{55})-$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}_{56})-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-$ 、オキサジアゾールジイル、チアジアゾールジイル

またはテトラゾールジイル；

X_3 はアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、ヘテロ環、シクロアルキル、シクロアルケニル、チアゾリニリデンメチル、チアソリジニリデンメチル、 $-CH=NR_6$ または $-N=C(R_7)R_8$ ；

R_5 、 R_{51} 、 R_{52} 、 R_{53} 、 R_{54} 、 R_{55} および R_{56} は水素またはアルキル；

R_6 は水素、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルバモイルオキシ、チオカルバモイルオキシ、ウレイドまたはチオウレイド；

R_7 および R_8 はそれぞれ独立してアルキル、アルコキシまたはアリール；

n は 1 または 2；

Z は $-SO_2-$ または $-CO-$ ；

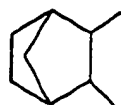
m は 0 または 1；

これらの定義において、置換基が環状のものはニトロ、アルコキシ、スルファモイル、置換もしくは非置換アミノ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、ハロゲン、アルキル、アルキニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アラルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、メシルオキシ、シアノ、アルケニルオキシ、ヒドロキシアルキル、トリフルオロメチル、アルキルチオ、 $-N=PPh_3$ 、オキソ、チオキソ、ヒドロキシイミノ、アルコキシイミノ、フェニルおよびアルキレンジオキシから選ばれる 1～3 個の基で置換されていてもよい）である化合物またはその塩もしくは水和物を有効成分として含有する PGD₂ 拮抗剤。

2. 有効成分が式 (I) で示される化合物において、



が、



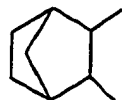
を表わし、 m が 0 であり、 Z が SO_2 のとき、 X_1 および X_2 がともに単結合であり、 X_3 がアルキル、フェニル、ナフチル、スチリル、キノリルまたはチエニルを表わし、これらの置換基のうち、環状のものがニトロ、アルコキシ、置換もし

くは非置換アミノ、ハロゲン、アルキルおよびヒドロキシアルキルから選ばれる
1～3個の基で置換されていてもよい化合物またはその塩もしくは水和物である
請求の範囲第1項記載のPGD₂拮抗剤。

3. 有効成分が式(I)で示される化合物において、



が、

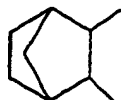


を表わし、mが1のとき、X₁およびX₂がともに単結合であり、X₃がハロゲン
で置換されていてもよいフェニルである化合物またはその塩もしくは水和物である
請求の範囲第1項記載のPGD₂拮抗剤。

4. 有効成分が式(I)で示される化合物において、



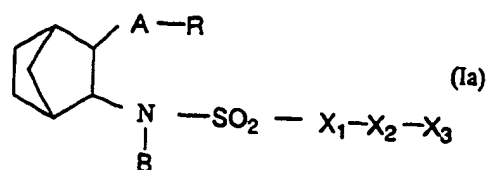
が、



を表わし、mが1のとき、X₁がフェニル、X₂が—CH₂—または—N=N—で
あり、X₃がフェニルである化合物またはその塩もしくは水和物である請求の範
囲第1項記載のPGD₂拮抗剤。

5. 鼻閉治療剤である請求の範囲第1項記載のPGD₂拮抗剤。

6. 式(Ia) :



(式中、A、B、R、 X_1 、 X_2 および X_3 が前記と同意義である。

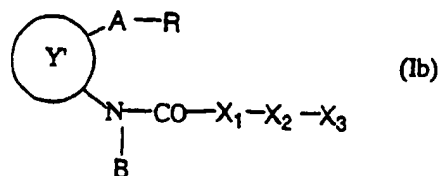
ただし、(1) X_1 および X_2 が単結合であり、 X_3 が置換もしくは非置換フェニルまたはナフチル、および(2) Aが5-ヘプテニレン、Rが COOR_1 (R_1 は水素またはメチル)、 X_1 が1,4-フェニレン、 X_2 が単結合、 X_3 がフェニルである場合を除く)で示される化合物またはその塩もしくは水和物。

7. X_1 および X_2 が単結合であり、 X_3 がイソオキサゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、モルホルル、インドリル、ベンゾフリル、ジベンゾフリル、ジベンゾジオキシニル、ベンゾチエニル、ジベンゾチエニル、カルバゾリル、キサントニル、フェナントリジニル、ジベンゾオキセピニル、ジベンゾチエピニル、シンノリル、クロメニル、ベンゾイミダゾリルまたはジヒドロベンゾチエピニルであり、A、B、R、は前記と同意義である請求の範囲第6項記載の化合物またはその塩もしくは水和物。

8. X_1 が単結合、 X_2 がフェニレン、 X_3 がアルケニル、アルキニル、 $-\text{CH}=\text{NR}_6$ または $-\text{N}=\text{C}(\text{R}_7)\text{R}_8$ を表わし、A、B、R、 R_6 、 R_7 および R_8 は前記と同意義である請求の範囲第6項記載の化合物またはその塩もしくは水和物。

9. Rが COOR_1 、 X_1 がフェニレンまたはチオフェンジイル、 X_2 が単結合、 $-\text{N}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CONH}-$ 、 $-\text{NHCO}-$ またはエチニレンおよび X_3 がフェニル、チアゾリニリデンメチル、チアゾリジニリデンメチルまたはチエニルを表わし、A、B、 R_1 、 R_6 、 R_7 および R_8 は前記と同意義である請求の範囲第6項記載の化合物またはその塩もしくは水和物。

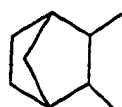
10. 式(Ib) :



(式中、



は、



または

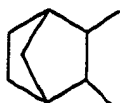


を表わし、A、B、R、 X_1 、 X_2 および X_3 が前記と同意義である。ただし、 X_1 および X_2 が単結合であり、 X_3 がフェニルである場合および X_1 が単結合で X_2 が一O—であるとき、 X_3 がベンジルである場合を除く)で示される化合物またはその塩もしくは水和物。

11. 式(Ib)で示される化合物において、



が、



を表わし、A、B、R、 X_1 、 X_2 および X_3 は前記と同意義である請求の範囲第10項記載の化合物またはその塩もしくは水和物。

12. Rが COOR_1 (R_1 は前記と同意義である)で示される請求の範囲第11項記載の化合物またはその塩もしくは水和物。

13. X_1 がフェニレンまたはチオフエンジイル、 X_2 が単結合、 $-\text{N}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、エチニレン、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CON}(\text{R}_{55})-$ (R_{55} は前記と同意義である) または $-\text{N}(\text{R}_{51})\text{CO}-$ (R_{51} は前記と同意義で

ある) および X_3 がフェニルまたはチエニルである請求の範囲第 11 項記載の化合物またはその塩もしくは水和物。

14. 式 (I b) で示される化合物において、



が、



を表わし、A、B、R、 X_1 、 X_2 、 X_3 および Z が前記と同意義である請求の範囲第 10 記載の化合物またはその塩もしくは水和物。

15. B が水素、 X_1 および X_2 がともに単結合であり、 X_3 がチエニル、チアソリル、チアジアソリル、イソチアソリル、ピロリル、ビリジル、ベンゾフリル、ベンゾイミダソリル、ベンゾチエニル、ジベンゾフリル、ジベンゾチエニル、キノリルまたはインドリルである請求の範囲第 14 記載の化合物またはその塩もしくは水和物。

16. X_1 がフェニレン、チオフェンジイル、インドールジイルまたはオキサゾールジイル、 X_2 が単結合、 $-N=N-$ 、 $-CH=CH-$ 、エチニレン、 $-S-$ または $-O-$ 、および X_3 がアリールまたはヘテロ環である請求の範囲第 15 記載の化合物またはその塩もしくは水和物。

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int. C1⁶ C07C233/52, 233/84, 271/24, 311/06, 311/11, 311/13, 311/19, C07D493/08, 495/08, A61K31/16, 31/18, 31/27, 31/33, 31/34, 31/35, 31/38
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int. C1⁶ C07C233/52, 233/84, 271/24, 311/06, 311/11, 311/13, 311/19, C07D493/08, 495/08, A61K31/16, 31/18, 31/27, 31/33, 31/34, 31/35, 31/38

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAS ONLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP, 6-279395, A (Ono Pharmaceutical Co., Ltd.), October 4, 1994 (04. 10. 94) & EP, 608847, A	1 - 16
X	JP, 2-180862, A (Ono Pharmaceutical Co., Ltd.), July 13, 1990 (13. 07. 90) & EP, 312906, A & US, 5168101, A	1 - 16
X	JP, 63-139161, A (Shionogi & Co., Ltd.), June 10, 1988 (10. 06. 88) & EP, 226346, A & US, 4861913, A & US, 4960909, A & US, 4976891, A & US, 5041635, A & US, 5043451, A & US, 5043456, A	1 - 16
X	JP, 60-178876, A (E.R. Squibb & Sons, Inc.), September 12, 1985 (12. 09. 85) & EP, 150709, A & US, 4526901, A	1 - 16

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
September 13, 1996 (13. 09. 96)

Date of mailing of the international search report
September 24, 1996 (24. 09. 96)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁶ C07C233/52, 233/84, 271/24, 311/06, 311/11, 311/13, 311/19, C07D493/08, 495/08, A61K31/16, 31/18, 31/27, 31/33, 31/34, 31/35, 31/38

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁶ C07C233/52, 233/84, 271/24, 311/06, 311/11, 311/13, 311/19, C07D493/08, 495/08, A61K31/16, 31/18, 31/27, 31/33, 31/34, 31/35, 31/38

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAS ONLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	J P, 6-279395, A (小野薬品工業株式会社) 4. 10月. 1994 (04 . 10. 94) & EP, 608847, A	1-16
X	J P, 2-180862, A (小野薬品工業株式会社) 13. 7月. 1990 (13 . 07. 90) & EP, 312906, A, & US, 5168101, A	1-16
X	J P, 63-139161, A (塩野義製薬株式会社) 10. 6月. 1988 (10 . 06. 88) & EP, 226346, A, & US, 4861913, A, & US,	1-16

☒ C欄の続きにも文献が列举されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

13. 09. 96

国際調査報告の発送日

24.09.96

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

印

4H

7106

佐藤 修

電話番号 03-3581-1101 内線 3445

C (続き). 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	4960909, A, &US, 4976891, A, &US, 5041635, A, US, 5043451, A, &US, 5043456, A JP, 60-178876, A (イー・アール・スクイブ・アンド・サンズ・インコ ーポレイテッド) 12. 9月. 1985 (12. 09. 85), &EP, 15070 9, A, &US, 4526901, A	1-16

